

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2015-530995

(P2015-530995A)

(43) 公表日 平成27年10月29日(2015.10.29)

| (51) Int. Cl.          | F I                  | テーマコード (参考) |
|------------------------|----------------------|-------------|
| AO 1 N 43/40 (2006.01) | AO 1 N 43/40 1 O 1 A | 2 B 1 2 1   |
| AO 1 N 43/60 (2006.01) | AO 1 N 43/60         | 4 H O 1 1   |
| AO 1 N 43/08 (2006.01) | AO 1 N 43/08 H       |             |
| AO 1 N 31/08 (2006.01) | AO 1 N 31/08         |             |
| AO 1 N 37/02 (2006.01) | AO 1 N 43/08 C       |             |

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 117 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2015-527657 (P2015-527657)  
 (86) (22) 出願日 平成25年8月16日 (2013. 8. 16)  
 (85) 翻訳文提出日 平成27年2月27日 (2015. 2. 27)  
 (86) 国際出願番号 PCT/US2013/055330  
 (87) 国際公開番号 W02014/028835  
 (87) 国際公開日 平成26年2月20日 (2014. 2. 20)  
 (31) 優先権主張番号 61/684, 242  
 (32) 優先日 平成24年8月17日 (2012. 8. 17)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)  
 (31) 優先権主張番号 61/805, 172  
 (32) 優先日 平成25年3月26日 (2013. 3. 26)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)  
 (31) 優先権主張番号 61/858, 931  
 (32) 優先日 平成25年7月26日 (2013. 7. 26)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 515042971  
 オルファクター ラボラトリーズ インコーポレイテッド  
 OLFACTOR LABORATORIES, INC.  
 アメリカ合衆国 92507 カリフォルニア州 リバーサイド スプルース ストリート 1650 フィフス フロア  
 (74) 代理人 100105957  
 弁理士 恩田 誠  
 (74) 代理人 100068755  
 弁理士 恩田 博宣  
 (74) 代理人 100142907  
 弁理士 本田 淳

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 昆虫の誘引および撃退のための組成物および方法

(57) 【要約】

本発明は、昆虫誘引剤および忌避剤と、蚊および他の吸血性有害生物などの媒介有害生物の捕捉方法および/またはその行動パターンの変更方法とを提供する。

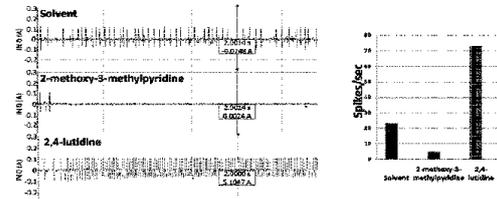


FIG. 1

**【特許請求の範囲】****【請求項 1】**

化合物 O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 1 2 1 のうちの少なくとも 1 つを含む組成物。

**【請求項 2】**

前記組成物が、化合物 O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 0 1 3 からなる群から選択される化合物を含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 3】**

前記化合物が少なくとも 0 . 0 1 % の濃度で存在する、請求項 2 に記載の組成物。

**【請求項 4】**

前記化合物が約 0 . 0 1 % ~ 約 5 % の濃度で存在する、請求項 2 に記載の組成物。

10

**【請求項 5】**

前記組成物が 2 つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 0 0 4、O L I 0 0 0 6 ~ O L I 0 0 0 8、O L I 0 0 1 0、O L I 0 0 1 1、O L I 0 0 1 3 ~ O L I 0 0 1 5、O L I 0 0 1 7、O L I 0 0 1 8、O L I 0 0 2 0 ~ O L I 0 0 2 2、O L I 0 0 2 4、O L I 0 0 2 5、O L I 0 0 2 7、O L I 0 0 9 6、O L I 0 0 9 7 および O L I 0 0 9 9 からなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 6】**

各化合物が少なくとも 0 . 0 1 % の濃度で存在する、請求項 5 に記載の組成物。

**【請求項 7】**

各化合物が約 0 . 0 1 % ~ 約 5 % の濃度で存在する、請求項 5 に記載の組成物。

20

**【請求項 8】**

少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 2 7、O L I 0 0 9 6、O L I 0 0 9 7 および O L I 0 0 9 9 からなる群から選択されるベータ活性化剤である、請求項 7 に記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記組成物が 2 つの化合物の組み合わせを含み、各化合物が独立して、O L I 0 0 0 6、O L I 0 0 0 8、O L I 0 0 1 3 ~ O L I 0 0 2 2、O L I 0 0 2 4 ~ O L I 0 0 2 9、O L I 0 0 6 3、O L I 0 0 9 1、O L I 0 0 9 2、O L I 0 0 9 6 ~ O L I 0 1 0 0 からなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

30

**【請求項 10】**

各化合物が少なくとも 0 . 0 1 % の濃度で存在する、請求項 9 に記載の組成物。

**【請求項 11】**

各化合物が約 0 . 0 1 % ~ 約 5 % の濃度で存在する、請求項 9 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 2 7 および O L I 0 0 9 6 ~ O L I 0 1 0 0 からなる群から選択されるベータ活性化剤である、請求項 11 に記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記組成物が相乗的な化合物の組み合わせを含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 14】**

前記相乗的な組み合わせの少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 1 4 ~ O L I 0 0 1 8、O L I 0 0 2 2、O L I 0 0 2 4、O L I 0 0 2 5、O L I 0 0 2 7 および O L I 0 0 2 9 からなる群から選択される、請求項 13 に記載の組成物。

40

**【請求項 15】**

前記相乗的な組み合わせが、O L I 0 0 1 9 ~ O L I 0 0 2 1、O L I 0 0 2 5、O L I 0 0 2 6、O L I 0 0 2 8、O L I 0 0 6 3、O L I 0 0 9 1、O L I 0 0 9 2 および O L I 0 1 0 0 からなる群から選択される少なくとも 1 つの他の化合物を含む、請求項 14 に記載の組成物。

**【請求項 16】**

前記組成物が、O L I 0 0 6 7 ~ O L I 0 0 7 0 からなる群から選択される化合物を含む

50

、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記組成物が 2 つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも 1 つの化合物が、OLI0015、OLI0067～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記少なくとも 1 つの化合物の濃度が少なくとも 0.01% である、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記少なくとも 1 つの化合物の濃度が約 0.01%～約 5% である、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記組成物が、OLI0074、OLI0084およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも 1 つのベータ活性化剤を含む、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記組成物が相乗的な組み合わせを含む、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記組成物が、OLI0076、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも 1 つの環境に優しい化合物を含む、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記組成物が 3 つの化合物の組み合わせを含み、各化合物が、OLI0068、OLI0071、OLI0072、OLI0074、OLI0078、OLI0080、OLI0100およびOLI0102からなる群から個々に選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 24】

少なくとも 1 つの化合物が、OLI0076、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される環境に優しい化合物を含む、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記少なくとも 1 つの化合物が、OLI0074およびOLI0100からなる群から選択されるベータ活性化剤を含む、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記相乗的な組み合わせが、OLI0071、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも 1 つの化合物を含む、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記相乗的な組み合わせが、OLI0015、OLI0072～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0095およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも 1 つの他の化合物を含む、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

媒介有害生物の行動を変更する方法であって、前記媒介有害生物を請求項 1 に記載の組成物に曝露することを含む方法。

【請求項 29】

前記媒介有害生物の行動変更が、前記媒介有害生物におけるCO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性およびCO<sub>2</sub> 受容体活性のうちの少なくとも一方の増大を含む、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 30】

前記媒介有害生物が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニおよびマダニのうちの少なくとも 1 つである、請求項 29 に記載の方法。

10

20

30

40

50

## 【請求項 3 1】

前記組成物が、化合物 O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 0 1 3 からなる群から選択される化合物を含む、請求項 3 0 に記載の方法。

## 【請求項 3 2】

前記組成物が 2 つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 0 0 4、O L I 0 0 0 6 ~ O L I 0 0 0 8、O L I 0 0 1 0、O L I 0 0 1 1、O L I 0 0 1 3 ~ O L I 0 0 1 5、O L I 0 0 1 7、O L I 0 0 1 8、O L I 0 0 2 0 ~ O L I 0 0 2 2、O L I 0 0 2 4、O L I 0 0 2 5、O L I 0 0 2 7、O L I 0 0 9 6、O L I 0 0 9 7 および O L I 0 0 9 9 からなる群から選択される、請求項 3 0 に記載の方法。

10

## 【請求項 3 3】

前記少なくとも 1 つの化合物の濃度が少なくとも 0 . 0 1 % である、請求項 3 2 に記載の方法。

## 【請求項 3 4】

前記少なくとも 1 つの化合物の濃度が約 0 . 5 % ~ 約 5 % である、請求項 3 2 に記載の方法。

## 【請求項 3 5】

前記飛行性の双翅類が、蚊科 (C u l i c i d a e) の 1 つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (A e d e o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、アエデス (A e d e s) 属の 1 つまたは複数のメンバー (アエデス・アエギプティ (A e d e s a e g y p t i) を含むが限定されない)、アノフェレス (A n o p h e l e s) 属の 1 つまたは複数のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (A n o p h e l e s g a m b i a e) およびアノフェレス・アンヌリペス (A n o p h e l e s a n n u l i p e s) を含むが限定されない)、アルミゲレス (A r m i g e r e s) 属の 1 つまたは複数のメンバー、アユラキティア (A y u r a k i t i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ピロネルラ (B i r o n e l l a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ポリキンダ (B o r i c h i n d a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、カガシア (C h a g a s i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、コクイルレットィディア (C o q u i l l e t t i d i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、クレクス (C u l e x) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (C u l e x q u i n q u e f a s c i a t u s)、クレクス・モレストゥス (C u l e x m o l e s t u s)、クレクス・アンヌリロストリス (C u l e x a n n u l i r o s t r i s) およびクレクス・アウストラリクス (C u l e x a u s t r a l i c u s) を含むが限定されない)、クリセタ (C u l i s e t a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (D e i n o c e r i t e s) 属の 1 つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス (E r e t m a p o d i t e s) 属の 1 つまたは複数のメンバー、フィカルビア (F i c a l b i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ (G a l i n d o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス (H a e m a g o g u s) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア (H e i z m a n n i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ホドゲシア (H o d g e s i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、イソストミヤ (I s o s t o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ヨンベルキニア (J o h n b e l k i n i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、キミア (K i m i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、リマトゥス (L i m a t u s) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ルトジア (L u t z i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マラヤ (M a l a y a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マンソニア (M a n s o n i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (M a o r i g o e l d i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (M i m o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オニリオン (O n i r i o n) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オピフェクス (O p i f e x) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (O r t h o p o d o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (P s o r o p h o r a) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (R u n c h o m y i a) 属の 1 つまたは複数のメン

20

30

40

50



ルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (フレボトムス・パパタシ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とからなる群から選択される、請求項31または34に記載の方法。

【請求項36】

前記組成物が2つの化合物の組み合わせを含み、各化合物が独立して、OLI0006、OLI0008、OLI0013~OLI0022、OLI0024~OLI0029、OLI0063、OLI0091、OLI0092、OLI0096~OLI0100からなる群から選択される、請求項29に記載の方法。

10

【請求項37】

前記媒介有害生物が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニまたはマダニである、請求項36に記載の方法。

【請求項38】

前記飛行性の双翅類が、蚊科 (クリキダエ (*Culicidae*)) の1つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (*Aedeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、アエデス (*Aedes*) 属の1つまたは複数のメンバー (アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) を含むが限定されない)、アノフェレス (*Anopheles*) 属の1つまたは複数のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (*Anopheles gambi* 20  
*gambiae*) およびアノフェレス・アンヌリペス (*Anopheles annulipes*) を含むが限定されない)、アルミゲレス (*Armigeres*) 属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア (*Ayurakitia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ (*Bironella*) 属の1つまたは複数のメンバー、ボリキンダ (*Borichinda*) 属の1つまたは複数のメンバー、カガシア (*Chagasia*) 属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア (*Coquillettidia*) 属の1つまたは複数のメンバー、クレクス (*Culex*) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス (*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス (*Culex annulirostris*) およびクレクス・アウストラリクス (*Culex 30  
australicus*) を含むが限定されない)、クリセタ (*Culiseta*) 属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (*Deinocerites*) 属の1つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス (*Eretmapodites*) 属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア (*Ficalbia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ (*Galindomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス (*Haemagogus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア (*Heizmannia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア (*Hodgesia*) 属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ (*Isostomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヨンベルキニア (*Johnbelkinia*) 属の1つまたは複数のメンバー、キミア (*Kimia*) 属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス (*Limatus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア (*Lutzia*) 属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ (*Malaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア (*Manson* 40  
*sonia*) 属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opifex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トボミヤ (*Topomyia* 50

) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェパエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*))、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキプレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoofi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*)) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*)) を含むが限定されない)、およびフォルキポミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダノスム (*Simulium danosum*))、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プリーノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium posticatum*)) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツォミヤ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (ルツォミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*)) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (フレボトム

10

20

30

40

50

ス・パパタスイ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とからなる群から選択される、請求項 37 に記載の方法。

【請求項 39】

各化合物の濃度が少なくとも 0.01% である、請求項 38 に記載の方法。

【請求項 40】

各化合物の濃度が約 0.5% ~ 約 5% である、請求項 38 に記載の方法。

【請求項 41】

前記組成物が相乗的な化合物の組み合わせを含む、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 42】

前記相乗的な組み合わせの少なくとも 1 つの化合物が、OLI0014 ~ OLI0018、OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027 および OLI0029 からなる群から選択される、請求項 41 に記載の方法。

【請求項 43】

前記相乗的な組み合わせが、OLI0019 ~ OLI0021、OLI0025、OLI0026、OLI0028、OLI0063、OLI0091、OLI0092 および OLI0100 からなる群から選択される少なくとも 1 つの他の化合物を含む、請求項 42 に記載の方法。

【請求項 44】

前記飛行性の双翅類が、蚊科 (Culicidae) の 1 つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (*Aedeomyia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、アエデス (*Aedes*) 属の 1 つまたは複数のメンバー (アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) を含むが限定されない)、アノフェレス (*Anopheles*) 属の 1 つまたは複数のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (*Anopheles gambiae*) およびアノフェレス・アンヌリペス (*Anopheles annulipes*) を含むが限定されない)、アルミゲレス (*Armigeres*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、アユラキティア (*Ayurakitia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ピロネルラ (*Bironeilla*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ポリキンダ (*Borchinda*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、カガシア (*Chagasia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア (*Coquillettidia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、クレクス (*Culex*) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス (*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス (*Culex annulirostris*) およびクレクス・アウストラリクス (*Culex australicus*) を含むが限定されない)、クリセタ (*Culiseta*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (*Deinocerites*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス (*Eretmapodites*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、フィカルビア (*Ficalbia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ (*Galindomyia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス (*Haemagogus*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア (*Heizmannia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ホドゲシア (*Hodgesia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、イソストミヤ (*Isostomyia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ヨンベルキニア (*Johnbelkinia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、キミア (*Kimia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、リマトゥス (*Limatus*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ルトジア (*Lutzia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マラヤ (*Malaya*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マンソニア (*Mansonia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opifex*) 属の 1 つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomy*

10

20

30

40

50

ia) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つ  
 または複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属の1つまたは複数のメン  
 ー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャノンニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ (*Topomyia*)  
 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*)  
 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属  
 の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つ  
 または複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタ  
 エニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウイエオミヤ (*Wyeomyia*) 10  
 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまた  
 は複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*)  
 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*))、グロ  
 シナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディ  
 ペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、  
 グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロン  
 ギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ  
 ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァ  
 ンホオフィ (*Glossina vanhoofi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パル  
 リケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パ  
 ルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属  
 の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダノスム (*Simulium damnosum*))、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プルイノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium posticum*) 10  
 40  
 50

a t u m ) を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ(ルツオミヤ(*Lutzomyia*)属の1つまたは複数のメンバー(ルツオミヤ・ロンギバルピス(*Lutzomyia longipalpis*)を含むが限定されない)、およびフレボトムス(*Phlebotomus*)属の1つまたは複数のメンバー(フレボトムス・パパタスイ(*Phlebotomus papatasi*)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択される、請求項43に記載の方法。

【請求項45】

各化合物の濃度が少なくとも0.01%である、請求項44に記載の方法。

【請求項46】

各化合物の濃度が約0.5%~約5%である、請求項44に記載の方法。

【請求項47】

前記媒介有害生物の行動変更が、前記媒介有害生物におけるCO<sub>2</sub>応答性ニューロン活性およびCO<sub>2</sub>受容体活性のうちの少なくとも一方の低下を含む、請求項28に記載の方法。

【請求項48】

前記媒介有害生物が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サンガメ、ノミ、シラミ、ダニおよびマダニのうちの少なくとも1つである、請求項47に記載の方法。

【請求項49】

前記組成物が、OLI0067~OLI0070からなる群から選択される化合物を含む、請求項48に記載の方法。

【請求項50】

前記飛行性の双翅類が、蚊科(クリキダエ(*Culicidae*))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(*Aedeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(*Aedes*)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(*Aedes aegypti*)を含むが限定されない)、アノフェレス(*Anopheles*)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)およびアノフェレス・アンヌリペス(*Anopheles annulipes*)を含むが限定されない)、アルミゲレス(*Armigeres*)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(*Ayurakitia*)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(*Bironella*)属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ(*Borchinda*)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(*Chagasia*)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(*Coquillettidia*)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(*Culex*)属のメンバー(クレクス・クインクエファスキアトゥス(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス(*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス(*Culex annulirostris*)およびクレクス・アウストラリクス(*Culex australicus*)を含むが限定されない)、クリセタ(*Culiseta*)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(*Deinocerites*)属の1つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス(*Eretmapodites*)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(*Ficalbia*)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(*Galindomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(*Haemagogus*)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(*Heizmannia*)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(*Hodgesia*)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(*Isostomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア(*Johnbelkinia*)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(*Kimia*)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(*Limatus*)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(*Lutzia*)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(*Malaya*)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(*Mansonia*

10

20

30

40

50

) 属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opifex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トボミヤ (*Topomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディベス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoeffi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダンノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム

10

20

30

40

50

(*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム(*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ(*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プリノスム(*Simulium pruinosum*)およびシムリウム・ポスティカトゥム(*Simulium posticatum*)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ(ルツオミヤ(*Lutzomyia*)属の1つまたは複数のメンバー(ルツオミヤ・ロンギパルピス(*Lutzomyia longipalpis*)を含むが限定されない)、およびフレボトムス(*Phlebotomus*)属の1つまたは複数のメンバー(フレボトムス・パパタスイ(*Phlebotomus papatasi*)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択される、請求項49に記載の方法。

10

【請求項51】

前記組成物が2つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも1つの化合物が、OLI0015、OLI0067~OLI0078、OLI0080、OLI0082~OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される、請求項48に記載の方法。

【請求項52】

前記少なくとも1つの化合物の濃度が少なくとも0.01%である、請求項51に記載の方法。

20

【請求項53】

前記少なくとも1つの化合物の濃度が約0.01%~約5%である、請求項51に記載の方法。

【請求項54】

前記飛行性の双翅類が、蚊科(クリキダエ(*Culicidae*))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(*Aedeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(*Aedes*)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(*Aedes aegypti*)を含むが限定されない)、アノフェレス(*Anopheles*)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)およびアノフェレス・アンヌリペス(*Anopheles annulipes*)を含むが限定されない)、アルミゲレス(*Armigeres*)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(*Ayurakitia*)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(*Bironella*)属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ(*Borchinda*)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(*Chagasia*)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(*Coquillettidia*)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(*Culex*)属のメンバー(クレクス・クインクエファスキアトゥス(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス(*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス(*Culex annulirostris*)およびクレクス・アウストラリクス(*Culex australicus*)を含むが限定されない)、クリセタ(*Culiseta*)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(*Deinocerites*)属の1つまたは複数のメンバー、エレトマポディテス(*Eretmapodites*)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(*Ficalbia*)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(*Galindomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(*Haemagogus*)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(*Heizmannia*)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(*Hodgesia*)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(*Isostomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア(*Johnbelkinia*)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(*Kimia*)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(*Limatus*)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(*Lutzia*)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(*Malaya*)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(*Mansonia*

30

40

50

) 属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opifex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ (*Topomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディベス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoeffi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダンノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム

10

20

30

40

50

(*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム(*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ(*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プリノスム(*Simulium pruinosum*)およびシムリウム・ポスティカトゥム(*Simulium posticatum*)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ(ルツオミヤ(*Lutzomyia*)属の1つまたは複数のメンバー(ルツオミヤ・ロンギパルピス(*Lutzomyia longipalpis*)を含むが限定されない)、およびフレボトムス(*Phlebotomus*)属の1つまたは複数のメンバー(フレボトムス・パパタスイ(*Phlebotomus papatasi*)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択される、請求項53に記載の方法。

10

【請求項55】

前記組成物が3つの化合物の組み合わせを含み、各化合物が、OLIO068、OLIO071、OLIO072、OLIO074、OLIO078、OLIO080、OLIO100およびOLIO102からなる群から個々に選択される、請求項48に記載の方法。

【請求項56】

各化合物の濃度が少なくとも0.01%である、請求項55に記載の方法。

【請求項57】

各化合物の濃度が約0.01%~約5%である、請求項55に記載の方法。

20

【請求項58】

前記飛行性の双翅類が、蚊科(クリキダエ(*Culicidae*))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(*Aedeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(*Aedes*)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(*Aedes aegypti*))を含むが限定されない)、アノフェレス(*Anopheles*)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)およびアノフェレス・アンヌリペス(*Anopheles annulipes*))を含むが限定されない)、アルミゲレス(*Armigeres*)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(*Ayurakitia*)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(*Bironella*)属の1つまたは複数のメンバー、ボリキンダ(*Borichinda*)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(*Chagasia*)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(*Coquillettidia*)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(*Culex*)属のメンバー(クレクス・クインクエファスキアトゥス(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス(*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス(*Culex annulirostris*)およびクレクス・オーストラリクス(*Culex australicus*))を含むが限定されない)、クリセタ(*Culiseta*)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(*Deinocerites*)属の1つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス(*Eretmapodites*)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(*Ficalbia*)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(*Galindomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(*Haemagogus*)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(*Heizmannia*)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(*Hodgesia*)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(*Isostomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア(*Johnbelkinia*)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(*Kimia*)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(*Limatus*)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(*Lutzia*)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(*Malaya*)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(*Mansonia*)属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア(*Maorigoeldia*)属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ(*Mimomyia*)属の1つまたは複数のメン

30

40

50



olombaschense)、シムリウム・ブルイノスム(Simulium pruinatum)およびシムリウム・ポスティカトゥム(Simulium posticatum)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ(ルツオミヤ(Lutzomyia)属の1つまたは複数のメンバー(ルツオミヤ・ロンギパルピス(Lutzomyia longipalpis)を含むが限定されない)、およびフレボトムス(Phlebotomus)属の1つまたは複数のメンバー(フレボトムス・パパタスイ(Phlebotomus papatasi)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択される、請求項57に記載の方法。

【請求項59】

前記組成物が、OLI0001~OLI0012、OLI0014~OLI0022、OLI0024~OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0063、OLI0065~OLI0072、OLI0074、OLI0076~OLI0079、OLI0084、OLI0091~OLI0093、OLI0095~OLI0097、OLI0099~OLI0102、OLI0104~OLI0107、OLI0109~OLI0115およびOLI0118~OLI0121からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含む、請求項28に記載の方法。

【請求項60】

前記媒介有害生物がトコジラミである、請求項59に記載の方法。

【請求項61】

前記トコジラミが前記組成物によって忌避される、請求項60に記載の方法。

【請求項62】

前記組成物が少なくとも2つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも1つの化合物が、OLI0014~OLI0017、OLI0020、OLI0024、OLI0029およびOLI0102からなる群から選択される、請求項61に記載の方法。

【請求項63】

前記トコジラミが前記組成物に誘引される、請求項60に記載の方法。

【請求項64】

前記組成物が少なくとも2つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも1つの化合物が、OLI0007、OLI0008およびOLI0010からなる群から選択される、請求項63に記載の方法。

【請求項65】

媒介有害生物を殺す方法であって、前記媒介有害生物を請求項1に記載の組成物に曝露することを含む方法。

【請求項66】

前記組成物が、OLI0001~OLI0003、OLI0005、OLI0006、OLI0009、OLI0011~OLI0014、OLI0016、OLI0017、OLI0019、OLI0020、OLI0021、OLI0024~OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0065~OLI0077、OLI0079、OLI0084、OLI0091、OLI0092、OLI0096、OLI0097およびOLI0100~OLI0119からなる群から選択される1つまたは複数の殺生物剤を含む、請求項65に記載の方法。

【請求項67】

前記1つまたは複数の殺生物剤が約0.2mg/ml~約2mg/mlの濃度で存在する、請求項66に記載の方法。

【請求項68】

前記1つまたは複数の殺生物剤が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニおよびマダニのうちの少なくとも1つに対する殺生物活性を含む、請求項67に記載の方法。

【請求項69】

10

20

30

40

50

前記 1 つまたは複数の殺生物剤が約 50 ppm ~ 約 150 ppm の濃度で存在する、請求項 66 に記載の方法。

【請求項 70】

前記 1 つまたは複数の殺生物剤が約 0.1% ~ 約 0.5% の濃度で存在する、請求項 66 に記載の方法。

【請求項 71】

前記 1 つまたは複数の殺生物剤が、OLI0001 ~ OLI0003、OLI0005、OLI0006、OLI0008、OLI0009、OLI0011 ~ OLI0014、OLI0016、OLI0017、OLI0019、OLI0020、OLI0024 ~ OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0065 ~ OLI0077、OLI0079、OLI0084、OLI0091、OLI0092、OLI0096、OLI0097、OLI0100 ~ OLI0102、OLI0104 ~ OLI0107 および OLI0109 ~ OLI0119 からなる群から選択される殺幼虫剤を含む、請求項 69 または 70 に記載の方法。

10

【請求項 72】

前記殺幼虫剤が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエまたはヌカカのうちの 1 つまたは複数からの幼虫に対する殺幼虫活性を含む、請求項 71 に記載の方法。

【請求項 73】

化合物 OLI0001 ~ OLI0102 のうちの少なくとも 1 つを含むデバイス。

【請求項 74】

前記デバイスがパッチを含む、請求項 73 に記載のデバイス。

20

【請求項 75】

前記パッチが、紙、プラスチック、金属、布帛、ワックス、高分子材料、ポリエチレン、ポリプロピレン、ゴム、セルロース、シリコンゴムおよびセルロースベースの材料からなる群から選択される 1 つまたは複数の材料で構成される、請求項 74 に記載のデバイス。

【請求項 76】

前記パッチが約 1 cm<sup>2</sup> ~ 約 5 cm<sup>2</sup> の面積を含む、請求項 75 に記載のデバイス。

【請求項 77】

前記パッチが、円形、正方形、矩形、三角形および多角形からなる群から選択される形状を含む、請求項 76 に記載のデバイス。

30

【請求項 78】

前記パッチが接着剤を含む、請求項 77 に記載のデバイス。

【請求項 79】

前記パッチの適用前に前記接着剤を保護するためのフィルムまたは紙の層を含む、請求項 78 に記載のデバイス。

【請求項 80】

前記パッチの形状が正方形であり、辺の長さがそれぞれ 1.5 cm を含む、請求項 79 に記載のデバイス。

【請求項 81】

請求項 73、77 および 80 のいずれか一項に記載のデバイスを含む、媒介有害生物の忌避方法。

40

【請求項 82】

前記デバイスが被験体の皮膚、衣類または衣服に適用される、請求項 81 に記載の方法。

【請求項 83】

前記デバイスが、ポケット、コンパートメント、カセット、ボックスまたはクリップからなる群から選択されるホルダーの内部に配置されるか、あるいは前記ホルダーに取り付けられる、請求項 81 に記載の方法。

【請求項 84】

前記ホルダーが、プレスレット、ネックレス、リストバンド、首輪、アームバンド、衣類またはクリップ留め式デバイスからなる群から選択される付属デバイスを用いて被験体に

50

取り付けられる、請求項 8 3 に記載の方法。

【請求項 8 5】

前記付属デバイスが空気拡散器を含む、請求項 8 4 に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、昆虫誘引剤および忌避剤、ならびに蚊および他の吸血性有害生物などの媒介有害生物の捕捉方法および/またはその行動パターンの変更方法の分野に関する。

【背景技術】

【0002】

蚊が媒介する病気は毎年百万人を超える人々の死亡の原因である。マラリアはこのような病気の1つであり、熱帯および亜熱帯地方において重要な健康問題を引き起こす。別の世界的な致命的病気は、アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) によって伝染されるデング熱ウイルスであり、主にラテンアメリカおよびアジアにおいて毎年1億人の人々が感染する。また蚊が媒介する病気は米国においても増大している。1999年にニューヨーク州で最初にヒト感染が報告されて以来、ウエストナイルウイルスは南方および西方に着実に移動しており、現在米国本土の全ての州において検出が記録されている。東部ウマ脳炎 (EEE) は蚊によって伝染される別のアルボウイルスであり、これも、米国および中南米において人々に病気を引き起こしている。EEEの重篤な感染は発作および昏睡を特徴とし、これらの患者の約半分が死に至る。従って、蚊および他の媒介有害生物からヒトを保護するために、安全で効果的かつ手頃な価格の薬剤が世界中で必要とされている。

10

20

【0003】

蚊集団を防除するための多数のこれまでの方法および現在実施されている方法は、ヒトの健康にも環境の植物および動物種にも有害である化学物質に依存している。このような化学物質の1つはN, N - ジエチル - メタ - トルアミド (DEET) である。DEETは、1946年に最初に軍によって使用された後、1957年に昆虫忌避剤として登録された。225を超えるDEET含有製品が皮膚および/または衣類における使用のために登録されており、市場で最も広く利用される昆虫忌避剤となっている。残念ながら、DEETは哺乳類に健康被害をもたらす、筋肉制御に影響を与える酵素のアセチルコリンエステラーゼを阻害することが示されている。DEETの導入以来、市場に参入した新規の化合物はほとんどない。

30

【0004】

DEET以後に導入された1つの化合物はペルメトリンである。ペルメトリンは、ニューロンの細胞膜を不安定化し、最終的に昆虫の死をもたらす殺虫性神経毒である。ペルメトリンの哺乳類毒性は低い、眼または肺に接触すると害を及ぼし得る。また、水生動物および水界生態系に対するペルメトリンの毒性は高い。これらの化学物質およびその防除方法の有害な影響の認知度の高まりと共に、当該技術分野において、ヒトおよび環境に対するリスクを最小限にして昆虫集団および昆虫行動を防除するための方法、化合物および組成物を開発することが依然として必要とされている。

40

【0005】

メスの蚊は、主として呼気中の二酸化炭素 ( $CO_2$ ) の放出を介して、餌となる脊椎動物の血を追跡することが知られている (非特許文献1)。 $CO_2$  は、双翅 (*Diptera*) 目の全体にわたって高度に保存されるヘテロマー  $CO_2$  受容体タンパク質を発現する蚊の小顎鬚内の特殊なニューロンにおいて感知される。電気生理学および行動アッセイを用いる最近の研究により、特定の小分子は  $CO_2$  受容体を刺激または阻害し得ることが実証された (非特許文献2)。 $CO_2$  受容体を阻害するような分子は現在当該技術分野において蚊の妨害剤 (または忌避剤) として調査されているが、蚊の  $CO_2$  受容体活性を刺激する分子は、昆虫の捕捉における使用のために魅力的な標的である。持続的な活性化は  $CO_2$  受容体のシグナル伝達を飽和し、それにより、蚊が  $CO_2$  プルームを追跡できな

50

くし得るので、CO<sub>2</sub>受容体活性の強力が持続的な活性化剤が忌避的な結果を伴って「マスキング」効果を有し得ることも事実である。この状況では、CO<sub>2</sub>受容体活性化剤でも、被験体（例えば、ヒト、ならびにウシ、ウマ、ネコ、イヌ、およびブタを含むがこれらに限定されない他の動物）およびその居住区域との接触を低減するための忌避剤であると考えられるであろう。

【0006】

本発明は、CO<sub>2</sub>応答機構と直接相互作用をする化合物および組成物を提供する。これらの組成物は、その特異性および低毒性のために、蚊の防除における使用にとって望ましい。本明細書に記載される化合物は、いくつかの天然産物と、これらの化合物の環境およびヒトの健康に対する害を少なくする可能性のある、構造的に類似の合成分子とを含む。

10

【先行技術文献】

【非特許文献】

【0007】

【非特許文献1】ギリース(Gillies)M.T.著、「蚊(双翅(Diptera)目:クリキダエ(Culicidae))による宿主発見における二酸化炭素の役割(The role of carbon dioxide in host-finding by mosquitoes (Diptera: Culicidae))」、レビュー、プレティン・エントモロジー・リサーチ(review. Bull. Entomology Res.), 1980年、第70巻、p. 525~532

【非特許文献2】ターナー(Turner), S.L.ら著、「CO<sub>2</sub>感受性ニューロンの超持続的な活性化が蚊を混乱させる(Ultra-prolonged activation of CO<sub>2</sub>-sensing neurons disorients mosquitoes)」、ネイチャー(Nature)、2011年6月2日、第474(7349)巻、p. 87~91

20

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0008】

従って、本明細書に記載される媒介有害生物のCO<sub>2</sub>受容体活性を活性化および/または阻害する方法および組成物は、ヒトおよび環境に対するリスクを最小限にして、媒介有害生物の改善された防除に対する長年の切実な必要性に対処するための解決策を示す。

30

【課題を解決するための手段】

【0009】

いくつかの実施形態では、本発明は、媒介有害生物の行動を変化または変更する化合物および/または組成物を提供する。いくつかのこのような組成物は、化合物OLI0001~OLI0121のうち少なくとも1つを含み得る。このような組成物は、化合物OLI0001~OLI0013からなる群から選択される化合物を含み得る。このような化合物は、約0.01%~約5%の濃度で存在し得る。

【0010】

いくつかの実施形態では、本発明の組成物は2つの化合物の組み合わせを含むことができ、少なくとも1つの化合物は、OLI0001~OLI0004、OLI0006~OLI0008、OLI0010、OLI0011、OLI0013~OLI0015、OLI0017、OLI0018、OLI0020~OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択される。このような組成物内の化合物は、約0.01%~約5%の濃度で存在し得る。場合によっては、少なくとも1つの化合物は、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択されるベータ活性化剤である。いくつかの組成物は2つの化合物の組み合わせを含むことができ、各化合物は独立して、OLI0006、OLI0008、OLI0013~OLI0022、OLI0024~OLI0029、OLI0063、OLI0091、OLI0092、OLI0096~OLI0100からなる群から選択される。このような組成物内の化合物は、

40

50

約0.01%～約5%の濃度で存在し得る。いくつかのこのような組成物は、OLI0027およびOLI0096～OLI0100からなる群から選択される少なくとも1つのベータ活性化剤を含み得る。

#### 【0011】

いくつかの実施形態では、組成物は、相乗的な化合物の組み合わせを含み得る。いくつかの組成物は、OLI0014～OLI0018、OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027およびOLI0029からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含み得る。いくつかのこのような組成物は、OLI0019～OLI0021、OLI0025、OLI0026、OLI0028、OLI0063、OLI0091、OLI0092およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも1つの他の化合物を含み得る。

10

#### 【0012】

いくつかの実施形態では、本発明の組成物は、OLI0067～OLI0070からなる群から選択される化合物を含み得る。いくつかのこのような組成物は2つの化合物の組み合わせを含むことができ、少なくとも1つの化合物は、OLI0015、OLI0067～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される。このような組成物内のいくつかの化合物は、約0.01%～約5%の濃度で存在し得る。いくつかのこのような組成物は、OLI0074、OLI0084およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも1つのベータ活性化剤を含み得る。場合によっては、このような組成物は、相乗的な組み合わせを含み得る。場合によっては、このような組成物は、OLI0076、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも1つの環境に優しい化合物を含み得る。

20

#### 【0013】

いくつかの実施形態では、本発明の組成物は3つの化合物の組み合わせを含むことができ、各化合物は、OLI0068、OLI0071、OLI0072、OLI0074、OLI0078、OLI0080、OLI0100およびOLI0102からなる群から個々に選択される。このような組成物は、OLI0076、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも1つの環境に優しい化合物を含み得る。このような組成物は、OLI0074およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも1つのベータ活性化剤を含み得る。いくつかの組成物は、OLI0071、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含む相乗的な組み合わせを含み得る。このような組成物は、OLI0015、OLI0072～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0095およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも1つの他の化合物を含み得る。

30

#### 【0014】

いくつかの実施形態では、本発明は媒介有害生物の行動を変更する方法を提供しており、前記媒介有害生物を本発明の組成物に曝露することを含む。いくつかのこのような方法は、前記媒介有害生物におけるCO<sub>2</sub>応答性ニューロン活性および/またはCO<sub>2</sub>受容体活性の増大を含み得る。いくつかのこのような方法では、媒介有害生物は、飛行性の双翅類(flying dipteran)、蚊、スナバエ、ブユ(black fly)、ツェツェバエ、ヌカカ(biting midge)、トコジラミ、サシガメ(assassin bug)、ノミ、シラミ、ダニおよび/またはマダニである。いくつかのこのような方法の組成物は、化合物OLI0001～OLI0013からなる群から選択される化合物を含む。他の方法の組成物は2つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも1つの化合物は、OLI0001～OLI0004、OLI0006～OLI0008、OLI0010、OLI0011、OLI0013～OLI0015、OLI0017、OLI0018、OLI0020～OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択

40

50

される。いくつかのこのような化合物の濃度は約 0.5% ~ 約 5% であり得る。

【0015】

いくつかの方法によると、蚊科(クリキダエ(*Culicidae*))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(*Aedeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(*Aedes*)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(*Aedes aegypti*)を含むが限定されない)、アノフェレス(*Anopheles*)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)およびアノフェレス・アンヌリペス(*Anopheles annulipes*)を含むが限定されない)、アルミゲレス(*Armigeres*)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(*Ayurakitia*)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(*Bironella*)属の1つまたは複数のメンバー、ポリキング(*Borichinda*)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(*Chagasia*)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(*Coquillettidia*)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(*Culex*)属のメンバー(クレクス・クインクェファスキアトゥス(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス(*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス(*Culex annulirostris*)およびクレクス・アウストラリクス(*Culex australicus*)を含むが限定されない)、クリセタ(*Culiseta*)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(*Deinocerites*)属の1つまたは複数のメンバー、エレトマポディテス(*Eretmapodites*)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(*Ficalbia*)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(*Galindomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(*Haemagogus*)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(*Heizmannia*)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(*Hodgesia*)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(*Isostomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ヨンベルキニア(*Johnbelkinia*)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(*Kimia*)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(*Limatus*)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(*Lutzia*)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(*Malaya*)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(*Mansonia*)属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア(*Maorigoeldia*)属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ(*Mimomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン(*Onirion*)属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス(*Opihex*)属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ(*Orthopodomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ(*Psorophora*)属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ(*Runchomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、サベテス(*Sabethes*)属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ(*Shannoniana*)属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ(*Topomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス(*Toxorhynchites*)属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン(*Trichoprosopon*)属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス(*Tripterooides*)属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ(*Udaya*)属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア(*Uranotaenia*)属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ(*Verrallina*)属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ(*Wyeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ(*Zeugomyia*)属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない)と、グロシナ(*Glossina*)属のツェツェパエ(グロシナ・アウステニ(*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス(*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ(*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ(*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス(*Glossina*

*fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツィ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhooofi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinoides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・ブルイノスム (*Simulium pruinatum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium posticum*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツオミヤ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (ルツオミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (フレボトムス・パパタスイ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とからなる群から選択される飛行性の双翅類が影響され得る。

#### 【0016】

いくつかの実施形態では、本発明の方法は、2つの化合物の組み合わせを含む組成物の使用を含むことができ、各化合物は独立して、OLI0006、OLI0008、OLI0013~OLI0022、OLI0024~OLI0029、OLI0063、OLI0091、OLI0092、OLI0096~OLI0100からなる群から選択される。いくつかのこのような方法は、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニまたはマダニを含み得る媒介有害生物の防除において使用され得る。飛行性の双翅類は、蚊科 (クリキダエ (*Culicidae*)) の1つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (*Aedeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、アエデス (*Aedes*) 属の1つまたは複数のメンバー (アエデス

・アエギプティ (*Aedes aegypti*) を含むが限定されない)、アノフェレス (*Anopheles*) 属の1つまたは複数のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (*Anopheles gambiae*) およびアノフェレス・アンヌリペス (*Anopheles annulipes*) を含むが限定されない)、アルミゲレス (*Armigeres*) 属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア (*Ayurakitia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ (*Bironella*) 属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ (*Borichinda*) 属の1つまたは複数のメンバー、カガシア (*Chagasia*) 属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア (*Coquillettidia*) 属の1つまたは複数のメンバー、クレクス (*Culex*) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス (*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス (*Culex annulirostris*) およびクレクス・アウストラリクス (*Culex australicus*) を含むが限定されない)、クリセタ (*Culiseta*) 属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (*Deinocerites*) 属の1つまたは複数のメンバー、エレトマポディテス (*Eretmapodites*) 属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア (*Ficalbia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ (*Galindomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス (*Haemagogus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア (*Heizmannia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア (*Hodgesia*) 属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ (*Isostomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア (*Johnbelkinia*) 属の1つまたは複数のメンバー、キミア (*Kimia*) 属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス (*Limatus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア (*Lutzia*) 属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ (*Malaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア (*Mansonia*) 属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opihex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ (*Topomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロングペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glos*

*sina nigrofusca nigrofusca* )、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoofti*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinoides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダンノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プルイノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポスティカトゥム (*Simulium posticatum*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツオミヤ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (ルツオミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (フレボトムス・パパタスイ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とからなる群から選択され得る。いくつかのこのような方法によると、化合物は、約0.5%~約5%の濃度で存在し得る。いくつかの方法によると、組成物は、相乗的な化合物の組み合わせを含み得る。このような相乗的な組み合わせは、OLI0014~OLI0018、OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027 および OLI0029 からなる群から選択され得る。他の相乗的な方法によると、少なくとも1つの他の化合物は、OLI0019~OLI0021、OLI0025、OLI0026、OLI0028、OLI0063、OLI0091、OLI0092 および OLI0100 からなる群から選択され得る。

#### 【0017】

いくつかの実施形態では、本発明の方法は媒介有害生物の行動変更を含むことができ、前記媒介有害生物におけるCO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性および/またはCO<sub>2</sub> 受容体活性の低下を含む。いくつかのこのような方法は、OLI0067~OLI0070 からなる群から化合物が選択される組成物の使用を含み得る。いくつかのこのような方法によると、媒介有害生物は、蚊科 (クリキダエ (*Culicidae*)) の1つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (*Aedeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、アエデス (*Aedes*) 属の1つまたは複数のメンバー (アエデス・アエギプティ (*Aedes a*

egypti)を含むが限定されない)、アノフェレス(*Anopheles*)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)およびアノフェレス・アンヌリペス(*Anopheles annulipes*)を含むが限定されない)、アルミゲレス(*Armigeres*)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(*Ayurakitia*)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(*Bironella*)属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ(*Borichinda*)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(*Chagasia*)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(*Coquillettidia*)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(*Culex*)属のメンバー(クレクス・クインクエファスキアトゥス(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス(*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス(*Culex annulirostris*)およびクレクス・アウストラリクス(*Culex australicus*)を含むが限定されない)、クリセタ(*Culiseta*)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(*Deinocerites*)属の1つまたは複数のメンバー、エレトマポディテス(*Eretmapodites*)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(*Ficalbia*)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(*Galindomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(*Haemagogus*)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(*Heizmannia*)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(*Hodgesia*)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(*Isostomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア(*Johnbelkinia*)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(*Kimia*)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(*Limatus*)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(*Lutzia*)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(*Malaya*)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(*Mansonina*)属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア(*Maorigoeldia*)属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ(*Mimomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン(*Onirion*)属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス(*Opihex*)属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ(*Orthopodomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ(*Psorophora*)属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ(*Runchomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、サベテス(*Sabethes*)属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ(*Shannoniana*)属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ(*Topomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス(*Toxorhynchites*)属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン(*Trichoprosopon*)属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス(*Tripterooides*)属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ(*Udaya*)属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア(*Uranotaenia*)属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ(*Verrallina*)属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ(*Wyeomyia*)属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ(*Zeugomyia*)属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない)と、グロシナ(*Glossina*)属のツェツェバエ(グロシナ・アウステニ(*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス(*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ(*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ(*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス(*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ(*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ(*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス(*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム(*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ(*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ(*Glossina nigrofusca*

nigrofusca)、グロシナ・セヴェリニ(Glossina severini)、グロシナ・スクウェツイ(Glossina schwetzi)、グロシナ・タバニフォルミス(Glossina tabaniformis)、グロシナ・ヴァンホオフィ(Glossina vanhoofti)、グロシナ・カリギネア(Glossina caliginea)、グロシナ・フスキペス・フスキペス(Glossina fuscipes fuscipes)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ(Glossina fuscipes martinii)、グロシナ・バルリケラ・バルリケラ(Glossina pallicera pallicera)、グロシナ・バルリケラ・ネウステアディ(Glossina pallicera newsteadii)、グロシナ・パルパリス・パルパリス(Glossina palpalis palpalis)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス(Glossina palpalis gambiensis)およびグロシナ・タキノイデス(Glossina tachinoides)を含むが、これらに限定されない)と、ケラトポゴニダエ(Ceratopogonidae)科のヌカカ(クリコイデス(Culicoides)属の1つまたは複数のメンバー(クリコイデス・ソノレンシス(Culicoides sonorensis)を含むが限定されない)、レプトコノプス(Leptoconops)属の1つまたは複数のメンバー(レプトコノプス・アルビヴェントリス(Leptoconops albiventris)およびレプトコノプス・トルレンス(Leptoconops torrens)を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ(Forcipomyia)属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない)と、シムリイダエ(Simuliidae)科のブユ(シムリウム(Simulium)属の1つまたは複数のメンバー(シムリウム・ダノスム(Simulium damnosum)、シムリウム・ネアヴェイ(Simulium neavei)、シムリウム・カルリドゥム(Simulium callidum)、シムリウム・メタルリクム(Simulium metallicum)、シムリウム・オクラケウム(Simulium ochraceum)、シムリウム・コロンバスケンセ(Simulium colombaschense)、シムリウム・プリーノスム(Simulium pruinosum)およびシムリウム・ポスティカトゥム(Simulium posticatum)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ(ルツォミヤ(Lutzomyia)属の1つまたは複数のメンバー(ルツォミヤ・ロンギパルピス(Lutzomyia longipalpis)を含むが限定されない)、およびフレボトムス(Phlebotomus)属の1つまたは複数のメンバー(フレボトムス・パパタスイ(Phlebotomus papatasi)を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択され得る。

【0018】

いくつかの方法は、組成物が2つの化合物の組み合わせを含む組成物の使用を含むことができ、少なくとも1つの化合物は、OLI0015、OLI0067~OLI0078、OLI0080、OLI0082~OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される。場合によっては、少なくとも1つの化合物の濃度は、約0.01%~約5%であり得る。場合によっては、媒介有害生物は、蚊科(クリキダエ(Culicidae))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(Aedeomyia)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(Aedes)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(Aedes aegypti)を含むが限定されない)、アノフェレス(Anopheles)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(Anopheles gambiae)およびアノフェレス・アンヌリペス(Anopheles annulipes)を含むが限定されない)、アルミゲレス(Armigeres)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(Ayurakitia)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(Bironella)属の1つまたは複数のメンバー、ボリキンダ(Borichinda)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(Chagasia)

属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア (*Coquilletti*  
*dia*) 属の1つまたは複数のメンバー、クレクス (*Culex*) 属のメンバー (クレクス・  
 クインケファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレ  
 クス・モレストゥス (*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス  
 (*Culex annulirostris*) およびクレクス・アウストラリクス (*Cu*  
*lex australicus*) を含むが限定されない)、クリセタ (*Culiseta*)  
 属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (*Deinocerites*) 属の  
 1つまたは複数のメンバー、エレトマポディテス (*Eretmapodites*) 属の1  
 つまたは複数のメンバー、フィカルビア (*Ficalbia*) 属の1つまたは複数のメン  
 10  
 10  
 20  
 20  
 30  
 30  
 40  
 40  
 50  
 50

ラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ニューステアディ (*Glossina pallicera news teadi*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpali s palpali s*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpali s gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinoi des*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoid es*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoid es sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プリーノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポスティカトゥム (*Simulium posticatum*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツオミヤ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (ルツオミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (フレボトムス・パパタスイ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とからなる群から選択される飛行性の双翅類である。

#### 【0019】

いくつかの実施形態では、本発明の方法は、3つの化合物の組み合わせを含む組成物を含むことができ、各化合物は、OLI0068、OLI0071、OLI0072、OLI0074、OLI0078、OLI0080、OLI0100およびOLI0102からなる群から個々に選択される。このような組成物内の化合物は、約0.01%~約5%の濃度で存在し得る。いくつかの実施形態では、このような方法は飛行性の双翅類の行動を変更するために使用されてもよく、ここで、飛行性の双翅類は、蚊科 (クリキダエ (*Culicidae*)) の1つまたは複数のメンバー (アエデオミヤ (*Aedeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、アエデス (*Aedes*) 属の1つまたは複数のメンバー (アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) を含むが限定されない)、アノフェレス (*Anopheles*) 属の1つまたは複数のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (*Anopheles gambiae*) およびアノフェレス・アンヌリペス (*Anopheles annulipes*) を含むが限定されない)、アルミゲレス (*Armigeres*) 属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア (*Ayurakitia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ (*Bironella*) 属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ (*Borichinda*) 属の1つまたは複数のメンバー、カガシア (*Chagasia*) 属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア (*Coquillettiadia*) 属の1つまたは複数のメンバー、クレクス (*Culex*) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・モレストゥス (*Culex molestus*)、クレクス・アンヌリロストリス (*Culex annulirostris*) およびクレクス・アウストラリクス (*Culex australicus*) を含むが限定されな

い)、クリセタ (*Culiseta*) 属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス (*Deinocerites*) 属の1つまたは複数のメンバー、エルトマポディテス (*Eretmapodites*) 属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア (*Ficalbia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ (*Galindomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス (*Haemagogus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア (*Heizmannia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア (*Hodgesia*) 属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ (*Isostomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヨンベルキニア (*Johnbelkinia*) 属の1つまたは複数のメンバー、キミア (*Kimia*) 属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス (*Limatus*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア (*Lutzia*) 属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ (*Malaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア (*Mansonina*) 属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス (*Opihex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ (*Runcomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トポミヤ (*Topomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない)と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*))、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキプレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハンングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoeffi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ニューステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに

10

20

30

40

50

限定されない)と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない)と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (*Simulium damnosum*)、*Simulium neavei*、*Simulium callidum*、*Simulium metallicum*、*Simulium ochraceum*、*Simulium colombaschense*、*Simulium pruinosum* および *Simulium posticatum* を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)と、スナバエ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属の1つまたは複数のメンバー (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない)を含むが、これらに限定されない)とからなる群から選択される。

10

20

30

40

50

#### 【0020】

いくつかの実施形態では、本発明の方法は、トコジラミの行動を変更するために使用され得る。このような方法は、OLI0001~OLI0012、OLI0014~OLI0022、OLI0024~OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0063、OLI0065~OLI0072、OLI0074、OLI0076~OLI0079、OLI0084、OLI0091~OLI0093、OLI0095~OLI0097、OLI0099~OLI0102、OLI0104~OLI0107、OLI0109~OLI0115 および OLI0118~OLI0121 からなる群から選択される少なくとも1つの化合物の使用を含み得る。場合によっては、トコジラミは、このような組成物によって忌避される。いくつかの実施形態では、トコジラミの忌避組成物は、OLI0014~OLI0017、OLI0020、OLI0024、OLI0029 および OLI0102 からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含み得る。他の方法によると、組成物は、トコジラミを誘引するために使用され得る。このような方法に従う誘引組成物は、少なくとも2つの化合物の組み合わせを含むことができ、少なくとも1つの化合物は、OLI0007、OLI0008 および OLI0010 からなる群から選択される。

#### 【0021】

いくつかの実施形態では、本発明の方法は1つまたは複数の媒介有害生物に対して殺生物性であることができ、本発明の1つまたは複数の組成物の使用を含み得る。このような方法は、OLI0001~OLI0003、OLI0005、OLI0006、OLI0009、OLI0011~OLI0014、OLI0016、OLI0017、OLI0019、OLI0020、OLI0021、OLI0024~OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0065~OLI0077、OLI0079、OLI0084、OLI0091、OLI0092、OLI0096、OLI0097 および OLI0100~OLI0119 からなる群から選択される1つまたは複数の殺生物剤を含む組成物の使用を含み得る。このような組成物は、約0.2 mg/ml~約2 mg/mlの濃度の殺生物剤を含み得る。このような殺生物剤は、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニおよび/またはマ

ダニのうちの1つまたは複数に影響を与え得る。いくつかの実施形態では、殺生物剤は、約50 ppm～約150 ppmの濃度で存在する。他の組成物では、殺生物剤は、約0.1%～約0.5%の濃度で存在し得る。他の実施形態では、このような方法は、OLI0001～OLI0003、OLI0005、OLI0006、OLI0008、OLI0009、OLI0011～OLI0014、OLI0016、OLI0017、OLI0019、OLI0020、OLI0024～OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0065～OLI0077、OLI0079、OLI0084、OLI0091、OLI0092、OLI0096、OLI0097、OLI0100～OLI0102、OLI0104～OLI0107およびOLI0109～OLI0119からなる群から選択される1つまたは複数の殺幼虫剤を含む組成物を含む。このような殺幼虫剤は、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエまたはヌカカのうちの1つまたは複数からの幼虫に対する殺幼虫活性を含み得る。

10

#### 【0022】

いくつかの実施形態では、本発明は、化合物OLI0001～OLI0102のうちの少なくとも1つを含むデバイスを提供する。いくつかのこのようなデバイスはパッチを含み得る。このようなパッチは、紙、プラスチック、金属、布帛、ワックス、高分子材料、ポリエチレン、ポリプロピレン、ゴム、セルロース、シリコンゴムおよびセルロースベースの材料からなる群から選択される1つまたは複数の材料を含み得る。場合によっては、パッチは、約1 cm<sup>2</sup>～約5 cm<sup>2</sup>の面積を含み得る。いくつかのパッチは、円形、正方形、矩形、三角形および多角形からなる群から選択される形状を含み得る。場合によっては、パッチは接着剤を含み得る。いくつかのパッチは、前記パッチの適用前に前記接着剤を保護するためのフィルムまたは紙の層を含み得る。いくつかのパッチの形状は正方形であり、辺の長さはそれぞれ1.5 cmを含み得る。いくつかのパッチは被験体の皮膚、衣類または衣服に適用され得る。

20

#### 【0023】

いくつかの実施形態では、本発明のデバイスは、ポケット、コンパートメント、カセット、ボックスまたはクリップからなる群から選択されるホルダーの内部に配置されてもよいし、あるいはホルダーに取り付けられてもよい。このようなホルダーは、プレスレット、ネックレス、リストバンド、首輪、アームバンド、衣類品またはクリップ留め式デバイスからなる群から選択される付属デバイスを用いて被験体に取り付けられてもよい。いくつかの実施形態では、付属デバイスは空気拡散器を含み得る。

30

#### 【0024】

上記および他の目的、特徴および利点は、添付図面に示されるように、本発明の特定の実施形態の以下の説明から明らかになるであろう。図面は必ずしも一定の縮尺ではなく、代わりに、本発明の種々の実施形態の原理の説明が強調されている。

#### 【図面の簡単な説明】

#### 【0025】

【図1】活性化剤および阻害剤および対照の間の比較を説明する、電気生理学追跡である。応答は、隣接するヒストグラムにおいてスパイク/秒として定量化される。図面は、電気生理学を用いて、試験化学物質の溶媒であるパラフィン油による二酸化炭素受容体の基礎活性(上部パネル)を、1%濃度の阻害剤2-メトキシ-3-メチルピリジン(中央パネル)、および活性化剤2,4-ルチジン(下部パネル)と比較して説明する。2-メトキシ-3-メチルピリジンは香料の使用が認可されており、「ナッツ」臭を有する。2,4-ルチジンは「グリーン」臭を有し、化粧品香料の使用が認可されており、フレーバー・アンド・エキストラクト・マニュファクチャラーズ・アソシエーション(Flavor and Extract Manufacturers Association (FEMA))によってGRAS化合物(一般に安全と認められる(Generally Recognized As Safe))に挙げられている。

40

【図2】着地(Landing)アッセイから得られるデータのヒストグラムである。着地アッセイは、アエデス・アエギプティ(Aedes aegypti)の誘惑物を同定

50

するように設計される。ヒストグラムのデータは、化合物シクロペンタノンおよび2-ペンタノンが対照と比較して誘惑物の機能を果たすことを示す。2-エチルピラジンはCO<sub>2</sub>受容体の活性化剤であり、このアッセイにおいて忌避剤としての機能を果たすことができる。

【図3】ネットスフェア(netsphere)アッセイから得られるデータのヒストグラムである。「ネットスフェアアッセイ」は、本明細書で使用される場合、広域で誘惑物または忌避剤の役割を果たすことができる化合物を同定するために使用されるセミフィールド痕跡アッセイである。ヒストグラムは、誘惑物であることが既に示されており、広域にわたって蚊を誘引するように作用することができる化合物シクロペンタノンおよび2-ペンタノンをを用いるサンプリングを示す。対照は、陽性対照の二酸化炭素および忌避剤化合物2,4-ルチジンを包含した。この実験は、アエデス・アエギプティ(Aedes aegypti)蚊を用いて実施した。

【発明を実施するための形態】

【0026】

媒介有害生物がヒトの状態に多大な影響を与えることを考えれば、これらの種が動物種、特にヒトおよび家畜における疾患の伝染に与える悪影響を最小限にするための組成物および方法を開発することは非常に興味深く、かつ不可避である。

【0027】

動物、特にヒトに対して有益であるように媒介有害生物の行動を変更する化合物の組成物(医薬組成物を含む)、ならびにその化合物の設計、調製および製造のための方法が本明細書において記載される。このような行動の変更は、媒介有害生物を多数の形態の本発明の化合物または組成物に曝露した結果であり得る。本明細書で使用される場合、「曝露」という用語は、媒介有害生物による化合物または組成物の感知を可能にするような形で、そしてそのために媒介有害生物に十分に近接して、化合物または組成物を物体、表面、区域、または領域に適用することを指す。結果として生じる行動の変更は、ヒトまたはヒトの居住地から離れた場所への誘引剤の形の化合物または組成物によって誘発されてもよいし、あるいは忌避剤の形の化合物または組成物によって誘発され、その結果、有害生物が人間またはその居住地へ向かってくることが阻止されてもよい。また、応答を飽和する濃度の受容体活性化剤の使用によって誘発されてもよく、最終結果は受容体の感知のマスクングをもたらす。従って、活性化化合物も媒介有害生物の忌避剤になり得る。本明細書で使用される場合、「誘引剤」は、1つまたは複数の有害生物を誘引することができる任意の化合物、組成物または組み合わせであり、「忌避剤」は、1つまたは複数の有害生物を忌避または阻止することができる任意の化合物、組成物または組み合わせである。誘引剤は、トラップの中の餌または誘惑物として使用され得る。本明細書で使用される場合、「餌」または「誘惑物」は、1つまたは複数の有害生物をトラップに誘引することができる任意の化合物、組成物、組み合わせ、物体または化学処理された物体である。方向性に関係なく、本発明の目的は、有害生物、特に媒介有害生物によって引き起こされるヒト(または動物)の健康に対する有害な影響を改善、低減、または排除する化合物、組成物および方法を提供することである。従って、本発明の化合物、組成物および/または組み合わせは、個人、個人群または大集団において媒介生物が運ぶ病気の予防のため、そして前記病気の蔓延の防止のために有用である。前記病気には、マラリア、デング熱、黄熱病、睡眠病、ウエストナイルウイルス、東部ウマ脳炎、河川盲目症、リンパ管フィラリア症、リーシュマニア症、流行性多発関節炎、オーストラリア脳炎などが含まれるが、これらに限定されない。

【0028】

本明細書で使用される場合、「有害生物」は、ヒトまたは他の動物に対して害、刺激、不快感または全体的な苛立ちを引き起こすいくつかの種のうちのいずれか1つを指す。「媒介有害生物」は、保有者から宿主へウイルス、細菌、原生動物または他の病原体を媒介および/または伝染させることができる生命体である。

【0029】

10

20

30

40

50

ほとんどの媒介有害生物は節足動物の昆虫であり、吸血性であり得る。有害生物または媒介有害生物は、刺咬性の昆虫も含み得る。半翅 (Hemiptera) 目の媒介有害生物は、トリアトミナエ (Triatominae) 亜科のサシガメ (メラノレステス (Melanolestes) 属、プラチメリス (Platymeris) 属、プセルリオプス (PSELLIOPUS) 属、ラサフス (Rasahus) 属、レドゥヴィウス (Reduvius) 属、シネア (Sinea) 属、トリアトマ (Triatoma) 属、およびゼルス (Zelus) 属のメンバーを含むが限定されない) と、キメクス (Cimex) 属のトコジラミ (キメクス・レクトゥラリウス (Cimex lectularius) を含むが限定されない) とを含み得るが、これらに限定されない。隠翅 (Siphonaptera) 目のノミである媒介有害生物は、クテノケファリデス (Ctenocephalides) 属 (クテノケファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis) およびクテノケファリデス・カニス (Ctenocephalides canis) を含むが限定されない)、プレクス (Pulex) 属 (プレクス・イルリタンス (Pulex irritans) を含むが限定されない)、ダシプシルルス (Dasyptillus) 属、ノソプシルルス (Nosopsyllus) 属およびキセノプシルラ (Xenopsylla) 属のメンバーを含み得るが、これらに限定されない。マダニ (Ixodida) 目である媒介有害生物は、ヌタルリエルリダエ (Nuttalliellidae) 科 (ヌタルリエルラ・ナマクア (Nuttalliella namaqua) を含む)、イクソディアエ (Ixodidae) 科 (イクソデス・スカブラリス (Ixodes scapularis)、イクソデス・ホロキュクルス (Ixodes holocyclus)、イクソデス・ヘキサゴヌス (Ixodes hexagonus)、イクソデス・パキフィクス (Ixodes pacificus)、イクソデス・リキヌス (Ixodes ricinus) およびイクソデス・ウリアエ (Ixodes uriae) を含むが限定されない)、およびアルガシダエ (Argasidae) 科のマダニを含み得るが、これらに限定されない。シラミ (Phthiraptera) 目のシラミである媒介有害生物は、ペディクルス (Pediculus) 属のメンバー (ペディクルス・フマヌス・カピティス (Pediculus humanus capitis) およびペディクルス・フマヌス・フマヌス (Pediculus humanus humanus) を含むが限定されない) と、プチルス (Pthirus) 属のメンバー (プチルス・プビス (Pthirus pubis) を含むが限定されない) とを含み得るが、これらに限定されない。飛行性の双翅類 (「飛行性の双翅類」という用語は、本明細書で使用される場合、飛行することができる双翅 (Diptera) 目の任意のメンバーを指す) を含む双翅 (Diptera) 目である媒介有害生物は、蚊科 (クリキダエ (Culicidae) のメンバー (アエデオミヤ (Aedeomyia) 属のメンバー、アエデス (Aedes) 属のメンバー (アエデス・アエギプティ (Aedes aegypti) を含むが限定されない)、アノフェレス (Anopheles) 属のメンバー (アノフェレス・ガンビアエ (Anopheles gambiae) およびアノフェレス・アンヌリペス (Anopheles annulipes) を含むが限定されない)、アルミゲレス (Armigeres) 属のメンバー、アユラキティア (Ayurakitia) 属のメンバー、ピロネルラ (Bironella) 属のメンバー、ポリキンダ (Borichinda) 属のメンバー、カガシア (Chagasia) 属のメンバー、コクイルレットティディア (Coquillettidia) 属のメンバー、クレクス (Culex) 属のメンバー (クレクス・クインクエファスキアトゥス (Culex quinquefasciatus)、クレクス・モレストゥス (Culex molestus)、クレクス・アンヌリロストリス (Culex annulirostris) およびクレクス・アウストラリクス (Culex australicus) を含むが限定されない)、クリセタ (Culiseta) 属のメンバー、デイノケリテス (Deinocerites) 属のメンバー、エレットマポディテス (Eretmapodites) 属のメンバー、フィカルビア (Ficalbia) 属のメンバー、ガリンドミヤ (Galindomyia) 属のメンバー、ハエマゴグス (Haemagogus) 属のメンバー

、ヘイズマンニア (*Heizmannia*) 属のメンバー、ホドゲシア (*Hodgesia*) 属のメンバー、イソストミヤ (*Isostomyia*) 属のメンバー、ヨンベルキニア (*Johnbelkinia*) 属のメンバー、キミア (*Kimia*) 属のメンバー、リマトゥス (*Limatus*) 属のメンバー、ルトジア (*Lutzia*) 属のメンバー、マラヤ (*Malaya*) 属のメンバー、マンソニア (*Mansonia*) 属のメンバー、マオリゴエルディア (*Maorigoeldia*) 属のメンバー、ミモミヤ (*Mimomyia*) 属のメンバー、オニリオン (*Onirion*) 属のメンバー、オピフェクス (*Opifex*) 属のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomyia*) 属のメンバー、プソロフォラ (*Psorophora*) 属のメンバー、ルンコミヤ (*Runchomyia*) 属のメンバー、サベテス (*Sabethes*) 属のメンバー、シャンノニアナ (*Shannoniana*) 属のメンバー、トポミヤ (*Topomyia*) 属のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属のメンバー、トリコプロソボン (*Trichoprosopon*) 属のメンバー、トリプテロイデス (*Tripteroides*) 属のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属のメンバー、ウラノタエニア (*Uranoetaenia*) 属のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属のメンバー、ウイエオミヤ (*Wyeomyia*) 属のメンバーおよびゼウゲノミヤ (*Zeugomyia*) 属のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキプレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロングペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoofi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadi*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinoides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属のメンバー (シムリウム・ダンノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリ

10

20

30

40

50

ウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プルイノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium posticatum*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツオミヤ (*Lutzomyia*) 属のメンバー (ルツオミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、およびフレボトムス (*Phlebotomus*) 属のメンバー (フレボトムス・パパタシ (*Phlebotomus papatasi*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) とを含み得るが、これらに限定されない。

10

### 【0030】

二酸化炭素 ( $\text{CO}_2$ ) 応答または活性のターゲティング

本発明は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロン活性を活性化、飽和および/または阻害するために有用な化合物および組成物を提供し、その受容体は、媒介有害生物の異なる種にわたって保存され、触覚または小顎鬚においてニューロンにより発現される。本明細書で使用される場合、「 $\text{CO}_2$  受容体」は、 $\text{CO}_2$  または  $\text{CO}_2$  レベルの変化に感知、結合、あるいは他の形で応答することができる受容体または他の細胞タンパク質である。「 $\text{CO}_2$  応答性ニューロン」は、 $\text{CO}_2$  を直接感知することができるニューロンであるか、あるいは  $\text{CO}_2$  レベルの変化に反応することができるニューロンであり、活性はこれらのレベルと関連する。

20

### 【0031】

本明細書で使用される場合、「ニューロン活性」は、電気生理学的方法を用いて検出することができる細胞インパルスを指す。

一実施形態では、開示される化合物および組成物は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンの活性化剤である。本明細書で使用される場合、「活性化剤」は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンにおけるニューロン活性を刺激することができる任意の化合物、組成物または組み合わせである。活性化剤は、媒介有害生物の行動を様々な点で変更することができ、従って、用途に応じて誘引剤または阻害剤の機能を果たし得る。

### 【0032】

1秒当たりのスパイク数 (spk/秒) で測定される活性化は、約20~300スパイク/秒 (spk/秒)、約20~200spk/秒、約20~100spk/秒、約20~80spk/秒、約20~60spk/秒、約20~40spk/秒、約40~300spk/秒、約40~200spk/秒、約40~100spk/秒、約40~80spk/秒、約40~60spk/秒、約60~300spk/秒、約60~200spk/秒、約60~100spk/秒、約60~80spk/秒、約100~300spk/秒または約100~200spk/秒の差で活性に反映され得る。「スパイク」は、細胞外単一感覚子の電気生理学によって記録されるようなニューロン活性のインパルスを指す。

30

### 【0033】

本発明の活性化剤は、穏やか、中程度、強力および非常に強力で分類される。「穏やかな活性化剤」は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンを直接活性化して、ニューロンのベースライン活性を20~40spk/秒上回るスパイク速度をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。「中程度の活性化剤」は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンを直接活性化して、ニューロンのベースライン活性を40~60spk/秒上回るスパイク速度をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。「強力な活性化剤」は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンを直接活性化して、ニューロンのベースライン活性を60~100spk/秒上回るスパイク速度をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。「非常に強力な活性化剤」は、 $\text{CO}_2$  応答性ニューロンを直接活性化して、ニューロンのベースライン活性を100spk/秒を超えて上回るスパイク速度をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。忌避応答を生じさせるために活性化剤が飽和濃度で送達される場合、これらの化合物、組成物または組み合わせは「マスクン

40

50

グ」剤と称される。従って、マスキング剤は、忌避剤または妨害剤と呼ぶこともできる。

【 0 0 3 4 】

いくつかの実施形態では、本発明の活性化剤化合物は、表 1 に記載されるもののいずれかを含むことができる。

【 0 0 3 5 】

【表 1 - 1】

表 1. 活性化剤化合物

| 化合物番号   | 化合物  |
|---------|--|
| OLI0001 | 2, 4-ルチジン  |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン  |
| OLI0003 | 2-メトキシピラジン   |
| OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン                                |
| OLI0005 | 4-エチルフェノール   |
| OLI0006 | 5-メチルフルフラール  |
| OLI0007 | ギ酸ブチル  |
| OLI0008 | シクロペンタノン   |
| OLI0009 | 2-フロ酸エチル   |
| OLI0010 | 乳酸エチル  |
| OLI0011 | エチルビニルカルピノール                                       |
| OLI0012 | グアヤコール   |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブテナール                                 |
| OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン                                  |
| OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジン                                      |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン                                    |
| OLI0017 | 2-フリルメチルケトン  |
| OLI0018 | 2-ペンタノン  |
| OLI0019 | 酪酸アリル  |
| OLI0020 | シンナミルニトリル  |
| OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル                                    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル   |
| OLI0023 | エチルビニルケトン  |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン  |
| OLI0025 | メタンチオールアセタート                                       |
| OLI0026 | クロトン酸メチル   |
| OLI0027 | レブリン酸メチル   |
| OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド                                       |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド                                      |
| OLI0030 | 2, 4-ジメチルベンズアルデヒド                                  |
| OLI0031 | 2, 4-ジメチル-3-シクロヘキセン-カルボキシア<br>ルデヒド (シス/トランス形態の混合物) |
| OLI0032 | 2-エチル-5(6)-メチルピラジン                                 |
| OLI0033 | 2-メトキシ-4-メチルフェノール                                  |
| OLI0034 | 2-フェニルプロピオンアルデヒド                                   |
| OLI0035 | 3-ヘキサノン  |
| OLI0036 | 4-エチルベンズアルデヒド                                      |
| OLI0037 | 4-オキソイソホロン   |

10

20

30

40

【表 1 - 2】

|         |                         |
|---------|-------------------------|
| OLI0038 | アセチル-2-ピラジン             |
| OLI0039 | ブタン酸ブタン-3-オン-2 イル       |
| OLI0040 | コハク酸ジメチル                |
| OLI0041 | ジプロピレングリコール-モノメチルエーテル   |
| OLI0042 | 3-ヒドロキシ酪酸エチル            |
| OLI0043 | エチル-2, 3, 5(6)-ジメチルピラジン |
| OLI0044 | ギ酸エチル                   |
| OLI0045 | イソ酪酸エチル                 |
| OLI0046 | イソ吉草酸エチル                |
| OLI0047 | レブリン酸エチル                |
| OLI0048 | フルフリルエチルエーテル            |
| OLI0049 | ヘプトアルデヒド                |
| OLI0050 | ヘプタノン-4                 |
| OLI0051 | ヘキサナール                  |
| OLI0052 | インドール                   |
| OLI0053 | 酢酸イソブチル                 |
| OLI0054 | プロピオン酸イソブチル             |
| OLI0055 | トランス-2-ブテン酸イソブチル        |
| OLI0056 | 酪酸イソプロピル                |
| OLI0057 | チグリニン酸イソプロピル            |
| OLI0058 | イソ吉草酸メチル                |
| OLI0059 | メチルヘプタジエノン              |
| OLI0060 | m-トルアルデヒド               |
| OLI0061 | o-アニスアルデヒド              |
| OLI0062 | 酢酸プレニル                  |
| OLI0063 | ギ酸プロピル                  |
| OLI0064 | R-+プレゴン                 |
| OLI0065 | トランス-シナナムアルデヒド          |
| OLI0066 | バレルアルデヒド                |

10

20

30

40

50

一実施形態では、開示される化合物および組成物はCO<sub>2</sub> 応答性ニューロンの阻害剤である。本明細書で使用される場合、「阻害剤」は、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロンにおけるニューロン活性を低下させることができる任意の化合物、組成物または組み合わせである。阻害剤は有害生物の行動を様々な点で変更することができ、従って、用途に応じて有害生物の誘引剤または忌避剤の機能を果たし得る。

## 【0037】

活性の相対的な低下として測定される阻害は、約20～100%、約20～80%、約20～60%、約20～40%、約40～100%、約40～80%、約40～60%、約60～100%または約60～80%の活性の低下に反映され得る。

## 【0038】

本発明の阻害剤は、穏やか、中程度および強力な阻害剤に分類される。「穏やかな阻害剤」は、化合物、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性を直接阻害して、ニューロンのベースライン活性と比較してニューロン活性の20～40%の低下をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。「中程度の阻害剤」は、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性を

直接阻害して、ニューロンのベースライン活性と比較してニューロン活性の40～60%の低下をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。「強力な阻害剤」は、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性を直接阻害して、ニューロンのベースライン活性と比較してニューロン活性の60%を超える低下をもたらすことができる化合物、組成物または組み合わせである。

【0039】

いくつかの実施形態では、本発明の阻害剤化合物は、表2に記載されるもののいずれかを含み得るが、これらに限定されない。

【0040】

【表2】

10

表2. 阻害剤化合物

| 化合物番号   | 化合物                       |
|---------|---------------------------|
| OLI0067 | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン        |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン              |
| OLI0069 | 2-エチル-3-メチルピラジン           |
| OLI0070 | 2-メトキシ-3-メチルピラジン          |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン          |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン |
| OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル              |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                |
| OLI0075 | オクタノン-3                   |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル               |
| OLI0077 | トランス-2-デセナール              |
| OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート        |
| OLI0079 | チグリニン酸1-エチルヘキシル           |
| OLI0080 | 1-オクタノール                  |
| OLI0081 | 2,5-ジメチル-4-メトキシ-3(2H)フラノン |
| OLI0082 | アルファ, アルファ-ジメチルフェネチルブチラート |
| OLI0083 | 酪酸シス-3-ヘキセニル              |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール           |
| OLI0085 | ニコチン酸エチル                  |
| OLI0086 | ヘプタン酸エチル                  |
| OLI0087 | ユーカリプトール                  |
| OLI0088 | ペンテン酸フルフリル                |
| OLI0089 | ゲラニルアセトン                  |
| OLI0090 | ゲラニルブチラート                 |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル                  |
| OLI0092 | メチルアミルケトン                 |
| OLI0093 | ローズマリー油                   |
| OLI0094 | ウイスキーラクトン                 |
| OLI0095 | ベラトルアルデヒド                 |

20

30

40

ベータ活性化剤

蚊の小顎鬚には3つのタイプのCO<sub>2</sub> 応答性ニューロンが存在する。これらには、cpA、cpBおよびcpCニューロンが含まれる。cpAニューロンからの活性は電気生理学的なアッセイの間に最大振幅のスパイクを生じるが、この領域に存在するcpBおよび

50

cpCニューロンは皮膚の臭気に応答性である(ルー(Lu), T.ら著、「マラリア媒介生物の蚊アノフェレス・ガンビアエ(Anopheles gambiae)の小顎鬚における臭気コーディング(Odor coding in the maxillary palp of the malaria vector mosquito Anopheles gambiae)」、カレント・バイオロジー(Curr Biol)、2007年9月、第18;17(18)巻、p.1533~44、Epub 2007年8月30日)。これらのニューロンは、cpAニューロンによって生じるスパイクよりもはるかに低い振幅を有するスパイクを生じる。cpBおよびcpCニューロンからの活性を互いに容易に区別することはできないが、これらの集合的な活性は、これらの特徴的なスパイクのためにcpAニューロンと区別することができる。これは、cpBおよびcpCニューロンだけを活性化または阻害する化合物および組成物、あるいは両方を活性化または阻害する化合物および組成物の同定において有用である。本明細書で使用される場合、「ベータ活性化剤」という用語は、cpBおよびcpCニューロン活性を刺激することができる任意の化合物または組成物を指す。

10

## 【0041】

いくつかの実施形態では、本発明のベータ活性化剤化合物は、表3に記載されるもののいずれかを含み得るが、これらに限定されない。

## 【0042】

## 【表3】

表3. ベータ活性化剤化合物

20

| 化合物番号   | 化合物              |
|---------|------------------|
| OLI0096 | ギ酸シス-3-ヘキセニル     |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル           |
| OLI0098 | ギ酸イソアミル          |
| OLI0099 | プロピオン酸イソアミル      |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル |
| OLI0101 | ペパーミント油          |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール  |
| OLI0079 | チグリン酸1-エチルヘキシル   |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         |

30

## 相乗的組成物

予想外なことに、本発明の特定の化合物は組み合わせると、ニューロン活性に対するその効果に関して相乗的な結果をもたらすことが分かった。例えば、いくつかの組み合わせは、穏やかまたは中程度の活性化剤化合物のみを含むにもかかわらず、強力な活性化剤であることが見出された。同様に、他の組み合わせは、穏やかまたは中程度の阻害剤化合物のみを含むにもかかわらず、相乗的な阻害剤であることが見出された。さらに、単一の化合物として適用されたときには個々に反対の機能を示す化合物を含むにもかかわらず、活性化剤または阻害剤のいずれかの役割を果たす相乗的な組み合わせが同定された。

40

## 【0043】

## 殺生物性および/または致死性の化合物

本発明のいくつかの組成物は、本明細書では「殺生物剤」とも呼ばれる殺生物性の薬剤を含み得る。本明細書で使用される場合、「殺生物性薬剤」または「殺生物剤」という用語は、生物学的生命体を防除する(例えば、成長を遅らせる、繁殖を遅らせる、忌避する、有害な影響を中和する、殺菌する、不動化する、そして/あるいは殺す)ことができる任意の薬剤を指す。いくつかの実施形態では、このような生命体は有害生物である。いくつかの実施形態では、このような有害生物は媒介有害生物(例えば、飛行性の双翅類、蚊

50

、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニまたはマダニ)である。本明細書で使用される場合、「殺生物活性」という用語は、所与の殺生物剤が持つ防除能力を指す。いくつかの実施形態では、殺生物剤は殺幼虫剤であり得る。本明細書で使用される場合、「殺生物剤」という用語は、1つまたは複数の幼虫に対して殺生物活性を示す薬剤を指す。このような幼虫は有害生物の幼虫であり得る。場合によっては、有害生物の幼虫は媒介有害生物の幼虫(例えば、双翅類の幼虫、蚊の幼虫、またはスナバエ、ブユ、ツェツェバエもしくはヌカカからの幼虫)を含む。

【0044】

いくつかの実施形態では、本発明の殺生物剤は致死性である。本明細書で使用される場合、「致死性」という用語は、このような薬剤に曝露される1つまたは複数の生命体の死を引き起こすことができる任意の薬剤を指すために使用される。いくつかの実施形態では、このような生命体は有害生物である。いくつかの実施形態では、このような有害生物は媒介有害生物である。本明細書で使用される場合、「致死率」という用語は、このような薬剤に曝露される1つまたは複数の生命体に所与の薬剤が死を引き起こす能力を指す。

10

【0045】

いくつかの実施形態では、本発明の殺生物性の化合物および/または組成物は、表4に記載される化合物のうちの1つまたは複数を含み得る。

【0046】

【表4】

表4. 殺生物性化合物

20

| 化合物番号   | 化合物                |
|---------|--------------------|
| OLI0005 | 4-エチルフェノール         |
| OLI0020 | シンナミルニトリル          |
| OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル    |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド      |
| OLI0052 | インドール              |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル        |
| OLI0077 | トランス-2-デセナール       |
| OLI0079 | チグリン酸1-エチルヘキシル     |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール    |
| OLI0102 | オイゲノール             |
| OLI0103 | ケイ皮酸フェネチル          |
| OLI0104 | ケイ皮酸アリル            |
| OLI0105 | プロピオン酸トランス-シンナミル   |
| OLI0106 | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール |
| OLI0107 | ギ酸シンナミル            |
| OLI0108 | イソ酪酸シンナミル          |
| OLI0109 | プロピオン酸シンナミル        |
| OLI0110 | ケイ皮酸エチル            |
| OLI0111 | メンタラクトン            |
| OLI0112 | メトキシケイ皮酸アルデヒド      |
| OLI0113 | ケイ皮酸メチル            |
| OLI0114 | トランス-ケイ皮酸メチル       |

30

40

殺生物活性を有する組成物は、様々な濃度の殺生物性化合物を含み得る。いくつかの実施形態では、このような組成物中の殺生物性化合物の濃度は、百万分の一(ppm)で測

50

定され得る。いくつかの組成物は、約 0.1 ppm ~ 約 2 ppm、約 1 ppm ~ 約 10 ppm、約 5 ppm ~ 約 50 ppm、約 50 ppm ~ 約 150 ppm、約 100 ppm ~ 約 200 ppm、約 200 ppm ~ 約 500 ppm、約 500 ppm ~ 約 1000 ppm、または少なくとも 1000 ppm を含み得る。他の実施形態では、組成物は、約 0.1% ~ 約 0.5%、約 0.25% ~ 約 1.5%、約 1% ~ 約 10%、約 5% ~ 約 20%、約 10% ~ 約 30%、約 15% ~ 約 35%、約 20% ~ 約 40%、約 30% ~ 約 50%、約 40% ~ 約 60%、約 50% ~ 約 75%、または少なくとも 75% の濃度の殺生物性化合物を含み得る。さらに他の実施形態では、殺生物性化合物は、約 0.01 mg/ml ~ 約 0.1 mg/ml、約 0.2 mg/ml ~ 約 2 mg/ml、約 1 mg/ml ~ 約 4 mg/ml、約 2 mg/ml ~ 約 5 mg/ml、約 5 mg/ml ~ 約 10 mg/ml、約 10 mg/ml ~ 約 20 mg/ml、約 15 mg/ml ~ 約 30 mg/ml、約 25 mg/ml ~ 約 50 mg/ml、約 40 mg/ml ~ 約 60 mg/ml、約 50 mg/ml ~ 約 75 mg/ml、約 70 mg/ml ~ 約 100 mg/ml、約 100 mg/ml ~ 約 500 mg/ml、約 500 mg/ml ~ 約 1 g/ml、または少なくとも 1 g/ml の濃度で殺生物性組成物中に存在し得る。

10

【0047】

いくつかの実施形態では、本発明の殺幼虫性化合物および/または組成物は、表 5 に記載される化合物のうちの 1 つまたは複数を含み得る。

【0048】

【表 5 - 1】

表 5. 殺幼虫性化合物

| 化合物番号   | 化合物                          |
|---------|------------------------------|
| OLI0001 | 2,4-ルチジン                     |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン                    |
| OLI0003 | 2-メトキシピラジン                   |
| OLI0005 | 4-エチルフェノール                   |
| OLI0006 | 5-メチルフルフラール                  |
| OLI0008 | シクロペンタノン                     |
| OLI0009 | 2-フロ酸エチル                     |
| OLI0011 | エチルビニルカルビノール                 |
| OLI0012 | グアヤコール                       |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブテナール           |
| OLI0014 | 2,3,5-トリメチルピラジン              |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン              |
| OLI0017 | 2-フリルメチルケトン                  |
| OLI0019 | 酪酸アリル                        |
| OLI0020 | シンナミルニトリル                    |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン                  |
| OLI0025 | メタンチオールアセタート                 |
| OLI0026 | クロトン酸メチル                     |
| OLI0027 | レブリン酸メチル                     |
| OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド                 |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド                |
| OLI0052 | インドール                        |
| OLI0059 | メチルヘプタジエノン                   |
| OLI0065 | トランス-シンナムアルデヒド               |
| OLI0066 | バレルアルデヒド                     |
| OLI0067 | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン           |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                 |
| OLI0069 | 2-エチル-3-メチルピラジン              |
| OLI0070 | 2-メトキシ-3-メチルピラジン             |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン             |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6) イソプロピルピラジン |
| OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル                 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                   |
| OLI0075 | オクタノン-3                      |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル                  |
| OLI0077 | トランス-2-デセナール                 |
| OLI0079 | チグリン酸 1-エチルヘキシル              |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール              |

10

20

30

40

【表 5 - 2】

|         |                          |
|---------|--------------------------|
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル                 |
| OLI0092 | メチルアミルケトン                |
| OLI0096 | ギ酸シス 3-ヘキセニル             |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル                   |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         |
| OLI0101 | ペパーミント油                  |
| OLI0102 | オイゲノール                   |
| OLI0104 | ケイ皮酸アリル                  |
| OLI0105 | プロピオン酸トランス-シンナミル         |
| OLI0106 | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール       |
| OLI0107 | ギ酸シンナミル                  |
| OLI0109 | プロピオン酸シンナミル              |
| OLI0110 | ケイ皮酸エチル                  |
| OLI0111 | メンタラクトン                  |
| OLI0112 | メトキシケイ皮酸アルデヒド            |
| OLI0113 | ケイ皮酸メチル                  |
| OLI0114 | トランス-ケイ皮酸メチル             |
| OLI0115 | メントール                    |
| OLI0116 | サリチルアルデヒド                |
| OLI0117 | イソ酪酸シンナミル                |
| OLI0118 | ウルトラズール(Ultrazur (登録商標)) |
| OLI0119 | 酪酸ヘキシル                   |

10

20

## トコジラミの忌避剤および誘引剤化合物

いくつかの実施形態では、本発明の化合物、組み合わせおよび/または組成物は、トコジラミの行動の制御に有用であり得る。キメクス(Cimex)属のトコジラミ(キメクス・レクトゥラリウス(Cimex lectularius))を含むが限定されない)は、ヒト(および他の動物)を刺咬して、血液を餌にする有害生物である。ヒトの血液を餌とするトコジラミは、特により暖かい住居内において、ヒトの就寝場所の中またはその周囲に生息することが多い。トコジラミによる刺咬は、発疹、アレルギー反応および心理的効果を含むがこれらに限定されない、健康に対するいくつかの悪影響に関連する。本発明のいくつかの化合物および/または化合物の組み合わせは、所与の被験体、領域または居住地からトコジラミを忌避するために使用することができる。本発明の他の化合物および/または化合物の組み合わせは、所与の被験体、領域または居住地からトコジラミを誘引するために使用することができる。

30

40

## 【0050】

化合物、組成物および組み合わせ

本発明によると、有害生物の誘引剤および/または忌避剤として有用な行動変更化合物が同定された。これらの化合物の多くは、異なる構造および化学特性に従って分類することができる。これらの分類には、芳香族化合物、ピラジン環含有化合物、フラン環含有化合物、ケトン、アルデヒド、アセタート、精油、環境的に安全な化合物、風味剤および臭気物質が含まれるが、これらに限定されない。

## 【0051】

ピラジン化合物 - 1つまたは複数のピラジン環構造を有する成分を含有する化合物および組成物が本明細書において開示される。ピラジン環は、グルコースおよびフルクトース

50

などの糖の存在下で、セリンおよびスレオニンを含む天然アミノ酸前駆体の熱分解によって形成することができる(テラニシ(Teranishi), R., 「フレーバー化学: 30年にわたる進歩(Flavor Chemistry: Thirty Years of Progress)」、スプリングー(Springer)、1999年)。ピラジン化合物は、様々な食品、特に水の非存在下高温で加工される食品において見出される。

#### 【0052】

フラン化合物 - 1つまたは複数のフラン環構造を有する成分を含有する化合物および組成物が本明細書において開示される。これらの化合物の多くは天然において見出すこともできるし、あるいはそれと性質が酷似した合成化学物質である。フラン自体は環状であり、式 $C_4H_4O$ を有する。これらは、他の化合物の化学合成の出発点として使用されることが多い。

10

#### 【0053】

精油 - 精油および/または精油に由来する化合物を含有する化合物および組成物が本明細書において開示される。「精油」という用語は、本明細書で使用される場合、植物から抽出される任意の揮発性芳香族液体を指す。通常、これらの化合物は、これらが抽出された植物の独特の香りを有する。抽出は、通常、濃縮された化合物の抽出を可能にする蒸留によって行われる。本発明の精油には、ローズマリー油、ユーカリプトール、ペパーミント油およびオイゲノールが含まれるが、これらに限定されない。また精油には、桂皮油、クローブ油、ハッカ油、ジャスミン油、ゲラニオール、カンファー油、ヒノキ油、セージ油、トウヒ(tohi)油、ザクロ油、ローズ油、テレピン油、ベルガモット油、マンダリン油、マツ油、ショウブ油、ラベンダー油、ベイ油、ヒバ油、レモン油、タイム油、メントール、シネオール、シトラル、シトロネラ、リナロール、ボルネオール、カンファー、チモール、スピラントール、ピネン、テルペン、リモネンなども含まれる。いくつかの精油またはその組み合わせは昆虫に関して忌避および/または誘引特性を有することが、当該技術分野において知られている。

20

#### 【0054】

オイゲノール(OI0102)はクローブ油中に高レベルで見出されるフェノール系精油であり、強力な抗菌および殺虫活性を有することが知られている。興味深いことに、オイゲノールは、マメコガネ(Japanese beetle)などのいくつかの昆虫に対する誘引剤の役割を果たすこともできる。FIFRA適用外化合物のリストに存在することにより、オイゲノールは殺虫剤、忌避剤または誘惑物における使用のために魅力的な候補とされる。

30

#### 【0055】

ペパーミント油は、ウォーターミントとスペアミントの交配種であるペパーミント植物から抽出される。ペパーミント油は、既知の忌避剤であるメントンが存在するため、現在天然の殺有害生物剤において使用されている。

#### 【0056】

ローズマリー油は、ローズマリー植物から抽出される。ローズマリー油は強力な芳香を有し、いくつかの殺有害生物剤の天然成分である。

40

グアヤコールは天然化合物であり、木タルクレオソートの成分である。グアヤコールは芳香族であり、解熱薬、消毒薬および去痰薬として医学的に使用されている。いくつかの実施形態では、本発明の化合物および/または組成物はグアヤコールを含む。

#### 【0057】

##### 製剤

組成物は製剤において組み合わせることができる。本明細書で使用される場合、「製剤」は、処方通りに調製される1つまたは複数の化合物または組成物の組み合わせであり、1つまたは複数の賦形剤、キャリアまたは送達剤を含み得る。製剤は乾燥していても湿っていてもよいし、あるいは固体でも液体でもよい。製剤は、1つまたは複数の特定の用途または使用のために設計され得る。本発明の製剤は組成物でもあり、組成物が処方され得

50

る。

【0058】

本発明の化合物、組成物または組み合わせの製剤は、昇華、噴霧、蒸発、ろうそくの燃焼などを介したエアロゾル化によって分散され得る。これらは、蒸気を時間をかけて放出するために、ブロック、ロッド、結晶、顆粒、ペレット、ビーズ、粉末などの固体として配備されてもよい。前記製剤は、持続放出のために設計され得る。

【0059】

別の実施形態では、本発明の化合物および組成物は、精製された液体または水性もしくは非水性（有機）の製剤のいずれかにおいて、液体形態で使用され得る。本明細書で使用される場合、「水性」という用語は、水と類似しているか、水含有するか、あるいは水中に溶解されること（例えば、水溶液）を意味する。本発明に従う「スラリー」は、大部分は不溶性である粒子の、通常水中の懸濁液である。適切な液体希釈剤またはキャリアは、水、石油蒸留物、または他の液体キャリアを含む。一実施形態では、前記希釈剤はさらに、界面活性剤を含む。非イオン性、アニオン性、両性、またはカチオン性の分散剤および乳化剤が使用され得る。液体製剤成分の選択は、組成物の使用目的、製剤内の活性化化合物の所望の分布、および製剤が所望の処置領域にわたって効果的に散布される能力によって決定される。前記液体製剤は、ローション、スプレー、エアロゾル、フォーム（泡）、ゲル、バーム、クリーム、ムース、パッチ（このような液体製剤を含む）、懸濁液、エマルジョン、マイクロエマルジョン、乳化可能な濃縮物、ポンプスプレー、香料、香水、コロソロン、ロールオン、固体スティック、ゲルスティック、ぬれナプキン、ワイプ、ウェットワイプ、軟膏、膏薬、ペーストなどの形態であり得る。

10

20

【0060】

一実施形態では、前記臭気物質または液体製剤は、所与の区域または個人もしくは個人群の近傍から媒介有害生物を忌避するための忌避剤として使用され得る。

別の実施形態では、前記臭気物質または液体製剤は、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性化を活性化するために使用される活性化剤製剤であり得る。さらなる実施形態では、前記活性化剤製剤は、所与の場所に媒介有害生物を引き寄せるか、あるいはあまり望ましくない場所から媒介有害生物を引き離すための誘引剤として用いられる。誘引場所は、媒介有害生物を捕獲するか、あるいは他の形で誘引するために配備されるトラップまたはデバイスであり得る。本発明の化合物または組成物は、当該技術分野において既知の誘引剤と共に処方され得る。これらの誘引剤製剤は、糖、蜂蜜、糖蜜、植物油、動物油（例えば、魚油など）、植物抽出物、花の香り、フェロモン、タンパク質、塩、種子、動物飼料、家畜飼料、粘着剤、接着剤（タングルウッド（tanglewood）などの物質を含む）などのうちの1つまたは複数を含み得る。別の実施形態では、活性化剤製剤は、保護されることが所望される個人または個人群に対する媒介有害生物の誘引を防止するための保護剤として使用され得る。これらの保護剤製剤は、媒介有害生物においてCO<sub>2</sub> 応答性ニューロンを圧倒し、これらが、保護されることが所望される個人または個人群から吐き出されるCO<sub>2</sub> プルームを追跡できなくする役割を果たし得る。

30

【0061】

本発明の化合物および組成物は、所与の被験体における局所使用のために処方され得る。一実施形態では、これらの局所製剤は被験体の皮膚に適用され得る。さらなる実施形態では、被験体は、イヌ、ネコ、ウマ、ウマ科動物、ウシ垂科動物、ブタ、ならびに二酸化炭素を吐き出す他の動物、および/または媒介有害生物に攻撃されやすい他の動物などの非ヒト動物であり得る。また化合物および組成物は、個人の衣類または衣服などの材料への適用のために処方されてもよい。このような材料は、寝具、網製品、ベッドネット、スクリーン、カーテン、壁、ギア、備品、パッチ、乗物などを含み得る。

40

【0062】

製剤の他の成分

本発明の化合物または組成物を含む製剤は、製剤の所望の使用に応じてさらなる成分を含み得る。これらの成分には、キャリア、増粘剤、界面活性剤、防腐剤、芳香族化合

50

物、脱臭剤、サンスクリーン活性物質、およびいくつかのタイプの補助剤（湿潤剤、展着剤、固着剤、発泡抑制剤、緩衝剤および酸性化剤を含むが限定されない）の1つまたは複数が含まれるが、これらに限定されない。本明細書で使用される場合、「サンスクリーン活性物質」は、表面から太陽紫外線の一部を吸収または反射することができる添加剤である。別の実施形態では、本発明の化合物および組成物は、用途に応じて所望の強度を達成するように希釈され得る濃縮物として供給され得る。「濃縮物」という用語は、本明細書で使用される場合、濃縮された形態の化合物または組成物を指す。従って、濃縮物はいくらかの希釈剤を含有していてもよく、必ずしも精製されていなくてもよい。

#### 【0063】

##### キャリア

本発明の化合物および組成物は、1つまたは複数のキャリアまたはキャリア媒体を含有し得る。これらのキャリアは気体、液体または固体でよく、ほとんどの場合は不活性であるが、活性材料でもあり得る。キャリア媒体は、フロンなどのエアロゾル噴射剤（標準の温度および圧力において気体状態で存在する）；不活性の分散性液体希釈キャリア（不活性有機溶媒を含む）、芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、アルキルナフタレンなど）、ハロゲン化、特に塩素化された芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼンなど）、塩素化脂肪族炭化水素（例えば、クロロエチレン、塩化メチレンなど）、シクロアルカン（例えば、シクロヘキサンなど）、パラフィン（例えば、石油または鉱油留分）、アセトニトリル、ケトン（例えば、シクロヘキサノン、メチルエチルケトン、アセトン、メチルイソブチルケトンなど）、アルコール（例えば、エタノール、メタノール、プロパノール、グリコール、ブタノールなど）ならびにそのエーテルおよびエステル（例えば、グリコールモノメチルエーテルなど）、アミド（例えば、ジメチルホルムアミドなど）、アミン（例えば、エタノールアミンなど）、スルホキシド（例えば、ジメチルスルホキシドなど）、および/または水を含むことができるが、これらに限定されない。またキャリアは、分散性であり得る不活性な微粉化固体キャリア、例えば、粉碎した天然鉱物（チョーク、すなわち、炭酸カルシウム、シリカ、アルミナ、パーミキュライト、タルク、珪藻土、アタパルジャイト、モンモリロナイトなどを含むが限定されない）、ならびに粉碎した合成鉱物（例えば、高度に分散したケイ酸、ケイ酸塩、例えばアルカリケイ酸塩など）などを含むこともできる。

#### 【0064】

##### 微粉化固体キャリア製剤

本発明の化合物および組成物は、粉塵、タルク、チョーク、ケイ藻土、パーミキュライト、砂、硫黄、小麦粉、アタパルジャイト粘土、珪藻土、葉ろう石、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよびマグネシウム、ならびにキャリアの役割を果たすことができる他の固体などの微粉化した固体キャリアによる分散のために処方されてもよい。媒介有害生物の行動を変更するために有用な典型的な微粉化固体製剤は、99部の前記微粉化固体キャリアにつき1部の化合物または組成物を含有する。一実施形態では、これらの微粉化固体は、約50マイクロメートルよりも大きい平均粒径を有する。別の実施形態では、前記微粉化固体は顆粒である。「顆粒」という用語は、本明細書で使用される場合、約400~2500マイクロメートルの直径の粒子を指す。前記顆粒は多孔質または非多孔質の粒子を含み得る。微粉化固体キャリアは、所望の化合物または組成物によって含浸または被覆されていてもよい。顆粒は一般に、0.05~15%、好ましくは0.5~5%の活性化合物または組成物を含有する。従って、本発明の忌避剤組成物は、ベントナイト、フラー土、粉碎天然鉱物（例えば、カオリン、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトなど）、粉碎合成鉱物（例えば、高度に分散したケイ酸、アルミナおよびケイ酸塩など）、破碎および分画された天然石（例えば、カルサイト、大理石、軽石、セピオライトおよびドロマイトなど）、無機および有機粉末の合成顆粒、ならびに有機材料の顆粒（例えば、おがくず、ココナッツ殻、コーン穂軸、タバコ茎、クルミまたは他のナッツ殻、卵殻、および製造または収穫の副産物でもそうでなくてもよい他の天然廃棄産物など）などの固体キャリアのいずれかと共に処方することができる。

## 【0065】

## 界面活性剤

本発明の化合物および組成物を含有する製剤は界面活性剤を含み得る。「界面活性剤」は、本明細書において言及される場合、液体の表面張力または液体および固体間の表面張力を低下させることができる添加剤である。界面活性剤は、乳化剤（例えば、非イオン性および/またはアニオン性乳化剤、脂肪酸のポリエチレンオキシドエステル、脂肪アルコールのポリエチレンオキシドエーテル、アルキル硫酸塩、アルキルスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、アルブミン加水分解物、アルキルアリールポリグリコールエーテル、ステアリン酸マグネシウム、オレイン酸ナトリウムなど）および/または分散剤（例えば、リグニン、亜硫酸塩廃液、メチルセルロースなど）を含むことができるが、これらに限定されない。

10

## 【0066】

## 増粘剤

本発明の化合物または組成物を含有する製剤は、1つまたは複数の増粘剤を含有し得る。「増粘剤」という用語は、本明細書で使用される場合、製剤の他の特性を有意に変更することなく、それが添加された製剤の粘度を増大させる添加剤を指す。これらは、製剤に均一の粘稠度を与えるためにも使用され得る。これらは、所与の製剤の成分を懸濁液中に保持するためにも有用である。前記増粘剤は、寒天、コーンスターチ、グアーガムおよびジャガイモデンプンを含むがこれらに限定されない。増粘剤は、全組成物の約0.1%～約5%の濃度で存在し得る。

20

## 【0067】

## 防腐剤

本発明の化合物または組成物を含有する製剤は、1つまたは複数の防腐剤を含有し得る。「防腐剤」という用語は、本明細書で使用される場合、組成物における崩壊、分解または腐敗を防止することができる添加剤を指す。前記防腐剤は天然物でも合成物でもよく、これらは広範囲の腐敗を防ぐこともできるし、あるいは1つの形態（例えば、微生物による、真菌による、またはカビによる腐敗など）をターゲットにすることもできる。防腐剤は、プロピオン酸カルシウム、硝酸ナトリウム、亜硝酸ナトリウム、二酸化硫黄、重硫酸ナトリウム、亜硫酸水素カリウム、エチレンジアミン四酢酸二ナトリウム（EDTA）、ホルムアルデヒド、グルタルアルデヒド、エタノール、メチルクロロイソチアゾリノン、ソルビン酸カリウムなどを含むことができるが、これらに限定されない。他の防腐剤は、化合物または組成物の化学分解を防ぐ。このような防腐剤は、ブチル化ヒドロキシアニソール（BHA）およびブチル化ヒドロキシトルエン（BHT）を含む。防腐剤は、通常、約0.03重量%～約3重量%の濃度で製剤中に存在する。

30

## 【0068】

## 他の材料

本発明の化合物および組成物は、当業者に知られており、所望の用途に応じて製剤に添加され得る「他の材料」を含み得る。これらには、乳、ニンニク、ニンニク粉末、ニンニク油、トウガラシ、白コショウ、黒コショウ油、ペペリン、化学的に処方されたコショウ、クローブ、魚油、任意選択で変性された油、タマネギ、香水、ビトレックス、チラム、チモール、カプサイシン、捕食者の尿、尿素、ナフタレン（モスポール）、ピレトリン、血液、血粉、骨粉、硫黄放出品（卵、硫黄、食肉など）、安息香酸デナトニウム、ホルムアルデヒド、アンモニア、メチルアンモニウム糖類、脂肪酸のアンモニウム、ワックス、栄養物、ブチルメルカプタン、鉱油、オレンジ油、ケルプ（海藻）、全卵、粉末卵、腐りかかった卵、卵白、卵黄、腐った卵、ローズマリー、タイム、ウィンターグリーン、粘土、2-プロペン酸、カリウム塩、2-プロペニアミド（propeniamide）、酢酸、鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン、亜鉛、ラテックス、動物性にかわ、およびヌーフイルム（nufilm）pおよびこのシリーズの他のもののようなステッカーが含まれるが、これらに限定されない。

40

## 【0069】

50

## 環境的に安全な化合物

本発明の化合物および組成物の製剤は、環境的に安全な化合物を含有し得る。本明細書で使用される場合、「環境的に安全な化合物」は、所与の生態系または環境に与える害が低減される、制限される、最小限である、そして／あるいは全くない化合物である。有害生物および刺咬性昆虫を防除するために、有害な化学物質が使用されることが多い。いくつかの化学物質によって市民の健康および環境に引き起こされる危険に対する市民意識の高まりと共に、合成および／または危険な化学物質の代替手段としてますます天然化合物が探索されている。この目的のために、環境保護庁 (Environmental Protection Agency) は、特定の天然化合物を安全であると分類し、これらの環境的に安全な化合物の使用を特定の政府規制から保護するための法的措置を取っている。連邦殺虫剤、殺菌剤および殺鼠剤法 (Federal Insecticide, Fungicide and Rodenticide Act) (FIFRA) は、適用外およびこの法律によって包含される化合物の概略を述べている。いくつかの実施形態では、環境的に安全な化合物は、連邦殺虫剤、殺菌剤および殺鼠剤法 (FIFRA) によって殺有害生物剤において使用するために環境的に安全であると同定されたものを含む。このような化合物には、(+) - 乳酸ブチル; (+) - 乳酸エチル; 1, 2 - 炭酸プロピレン; 1 - モノラウリン; 1 - モノミスチン; プロピオン酸 2 - フェネチル (プロピオン酸 2 - フェニルエチル); クエン酸アセチルトリブチル; 寒天; アーモンド外皮; アーモンド殻; アルファ - シクロデキストリン; アルミネートシリケート; アルミニウムマグネシウムシリケート; アルミニウムカリウムナトリウムシリケート; アルミニウムシリケート; アルミニウムナトリウムシリケート; アルミニウムナトリウムシリケート (1 : 1 : 1); 安息香酸アンモニウム; ステアリン酸アンモニウム; アミロペクチン、酸加水分解物、1 - オクテニルプタンジオアート; アミロペクチン、水素 1 - オクタデセニルプタンジオアート; 動物性にかわ; パルミチン酸アスコルビル; アタバルジャイト粘土; 蜜ろう; ベントナイト; ナトリウム含有ベントナイト (bentonite, sodian); ベータ - シクロデキストリン; 骨粉; ふすま; パンくず; 乳酸ブチル; ステアリン酸ブチル; 石灰質頁岩; カルサイト ( $\text{Ca}(\text{CO}_3)$ ); 酢酸カルシウム; 酢酸カルシウム一水和物; 安息香酸カルシウム; 炭酸カルシウム; クエン酸カルシウム; オクタン酸カルシウム; 酸化ケイ酸カルシウム ( $\text{Ca}_3\text{O}(\text{SiO}_4)$ ); ケイ酸カルシウム; ステアリン酸カルシウム; 硫酸カルシウム; 硫酸カルシウム二水和物; 硫酸カルシウム半水和物; カナリーシード; 炭素; 二酸化炭素; カルボキシメチルセルロース; 段ボール; カルナバワックス; イナゴマメガム; カラギナン; カゼイン; ヒマシ油; 水素化ヒマシ油; キャットフード; シダー油; セルロース; 酢酸セルロース; セルロース混合物 (セルロースカルボキシメチルエーテル、ナトリウム塩との); セルロースパルプ; 再生セルロース; チーズ; クロロフィル a; クロロフィル b; シナモンおよび桂皮油; クエン酸; クエン酸一水和物; シトロネラおよびシトロネラ油; シトラス粉; シトラスペクチン; シトラスパルプ; クラムシェル; クロップおよびクロップ油; ココア; ココア殻粉; ココア殻; タラ肝油; コーヒー粉末; クッキー; コルク; コーン穂軸; コーングルテン粉; コーン油; 綿; 綿実粉; 綿実油; 粗挽きの小麦粉; デカン酸、1, 2, 3 - プロパントリオールとのモノエステル; デキストリン; ケイ藻土 (1%未満の結晶性シリカ); モノオレイン酸ジグリセリル; モノステアリン酸ジグリセリル; ジラウリン; ジパルミチン; クエン酸二カリウム; クエン酸二ナトリウム; 硫酸二ナトリウム十水和物; ドデカン酸、1, 2, 3 - プロパントリオールとのモノエステル; ドロマイト; ベイマツ樹皮; 乾燥血液; 卵殻; 卵; 乳酸エチル; オイゲノール; 長石; 魚粉; 魚油 (40 CFR 180.950 に従わない); フラースト; フマル酸; ガンマ - シクロデキストリン; ニンニクおよびニンニク油; ゼラチン; ジェランガム; ゲラニオール; ゼラニウム油; にかわ (脱重合した動物コラーゲンとして); グリセリン; モノオレイン酸グリセロール; ジカプリル酸グリセリル; ジミスチン酸グリセリル; ジオレイン酸グリセリル; ジステアリン酸グリセリル; モノミスチン酸グリセリル; モノオクタン酸グリセリル; モノオレイン酸グリセリル; モノステアリン酸グリセリル; ステアリン酸グリセリル; 花崗岩; 黒鉛; グアーガム; アラビアガム; トラガ

10

20

30

40

50

カントガム；石膏；ヘマタイト（ $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ）；フミン酸；水素化綿実油；水素化菜種油；水素化大豆油；ヒドロキシエチルセルロース；ヒドロキシプロピルセルロース；ヒドロキシプロピルメチルセルロース；酸化鉄マグネシウム（ $\text{Fe}_2\text{MgO}_4$ ）；酸化鉄（ $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ）；酸化鉄（ $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ）水和物；酸化鉄（ $\text{Fe}_3\text{O}_4$ ）；酸化鉄（ $\text{FeO}$ ）；イソプロピルアルコール；ミリスチン酸イソプロピル；カオリン；ラクトース；ラクトース一水和物；ラノリン；ラテックスゴム；ラウリン酸；ラウリル硫酸塩；レシチン；レモンガラス油；甘草抽出物；ライム（ケミカル）ドロマイト；石灰岩；アマニ油；安息香酸マグネシウム；炭酸マグネシウム；酸化マグネシウム；酸化ケイ酸マグネシウム（ $\text{Mg}_3\text{O}(\text{Si}_2\text{O}_5)_2$ ）一水和物；ケイ酸マグネシウム；ケイ酸マグネシウム水和物；マグネシウムシリコンオキシド（ $\text{Mg}_2\text{Si}_3\text{O}_8$ ）；ステアリン酸マグネシウム；硫酸マグネシウム；硫酸マグネシウム七水和物；リンゴ酸；麦芽抽出物；麦芽フレーバー；マルトデキストリン；メチルセルロース；マイカ；マイカ群鉱物；乳；キビ種子；鉱油（U.S.P.）；ハッカおよびハッカ油；モノミリスチン；モノパルミチン；クエン酸一カリウム；クエン酸一ナトリウム；モンモリロナイト；ミリスチン酸；霞石閃長岩；窒素；ヌートリア肉；ナイロン；オクタン酸カリウム塩；オクタン酸ナトリウム塩；アーモンド油；小麦油；オレイン酸；カキ殻；ヤシ油；水素化ヤシ油；パルミチン酸；紙；パラフィンワックス；ピーナッツバター；ピーナッツ殻；ピーナッツ；ピートモス；ペクチン；ペパーミントおよびペパーミント油；パーライト；膨張パーライト；焼き石膏；ポリエチレン；オレイン酸ポリグリセリル；ステアリン酸ポリグリセリル；酢酸カリウム；カリウムアルミニウムシリケート、無水；安息香酸カリウム；重炭酸カリウム；塩化カリウム；クエン酸カリウム；フミン酸カリウム；ミリスチン酸カリウム；オレイン酸カリウム；リシノール酸カリウム；ソルビン酸カリウム；ステアリン酸カリウム；硫酸カリウム；硫酸カリウム；軽石；腐りかかった全卵固形分；赤キャベツ色素（酸性水のみを用いる加圧処理によって食用赤キャベツ株から搾られる）；レッドシダーチップ；レッドドッグ粉（red dog flour）；ローズマリーおよびローズマリー油；ゴム；おがくず；ゴマ（粉砕したゴマ植物の茎を含む）およびゴマ油；頁岩；シリカ（結晶質を含まない）；シリカゲル；結晶質を含まない沈殿シリカゲル；非晶質のヒュームドシリカ（結晶質を含まない）；非晶質シリカの沈殿およびゲル；シリカ水和物；ガラス質シリカ；ケイ酸（ $\text{H}_2\text{SiO}_3$ ）マグネシウム塩（1：1）；セッケン（脂肪および油のけん化、または脂肪酸の中和のいずれかによって生じる脂肪酸の水溶性ナトリウムまたはカリウム塩）；ソープバーク（soap bark）（キラヤサポニン）；ソープストーン；酢酸ナトリウム；アルギン酸ナトリウム；安息香酸ナトリウム；重炭酸ナトリウム；カルボキシメチルセルロースナトリウム；塩化ナトリウム；クエン酸ナトリウム；フミン酸ナトリウム；ラウリル硫酸ナトリウム；オレイン酸ナトリウム；リシノール酸ナトリウム；ステアリン酸ナトリウム；硫酸ナトリウム；ソルビトール；大豆タンパク質；大豆レシチン；大豆皮；大豆粉；大豆油；大豆粉末；ステアリン酸；硫黄；シロップ、水素化加水分解デンプン；モノオレイン酸テトラグリセリル；タイムおよびタイム油；クエン酸三カルシウム；クエン酸トリエチル；クエン酸三カリウム；クエン酸三カリウム一水和物；クエン酸三ナトリウム；クエン酸三ナトリウム脱水物；クエン酸三ナトリウム五水和物；ウルトラマリンブルー；尿素；バニリン；パーミキュライト；酢（溶液中に最大8%の酢酸）；ビタミンC；ビタミンE；クルミ粉末；クルミ殻；小麦；小麦粉；小麦胚芽油；乳清；白色鉱油（石油）；白コショウ；ウィンターグリーン油；ウォラストナイト（ $\text{Ca}(\text{SiO}_3)$ ）；羊毛；キサンタンガム；酵母；ゼオライト（エリオナイト（CAS登録番号66733-21-9）を除く）；ゼオライトNaA；酸化鉄亜鉛；亜鉛金属片（亜鉛金属および不純物のみからなる）；酸化亜鉛（ $\text{ZnO}$ ）およびステアリン酸亜鉛が含まれるが、これらに限定されない。

#### 【0070】

##### 他の芳香族化合物

本発明の化合物および組成物の製剤は、他の芳香族化合物または組成物を含有し得る。「芳香族」という用語は、本明細書で使用される場合、独特の匂いまたは芳香を有する化合物を指す。このような化合物は通常揮発性であり、周囲空気への急速な拡散が可能であ

10

20

30

40

50

り、嗅覚系内で容易に感知される。1つのこのような芳香族化合物はシダー油である。シダー油は、昆虫を忌避すると共に、水域に存在する蚊の幼虫を殺すその能力のために、所与の製剤において有用であり得る。シダー油製剤は、重量パーセントにより約0.01%～約10%、約1%～約5%、約2%～約20%、または約5%～約50%のシダー油を含有し得る。

#### 【0071】

本発明の化合物および組成物の製剤中に包含され得る他の芳香族化合物には、カンファー、ピレトリンおよびペルメトリンが含まれるが、これらに限定されない。このような製剤は、重量パーセントにより約0.01%～約10%、約1%～約5%、約2%～約20%、または約5%～約50%のカンファー、ピレトリンおよび/またはペルメトリンを含有し得る。

10

#### 【0072】

##### 補助剤

本発明の化合物および組成物の製剤は補助剤を含み得る。「補助剤」という用語は、本明細書で使用される場合、製剤内の別の成分の1つまたは複数の特性を改善または増強する任意の物質を指す。前記補助剤は、緩衝剤、酸性化剤、湿潤剤、展着剤、固着剤、接着剤、着色剤、安定剤、防水剤、発泡抑制剤などを含み得るが、これらに限定されない。

#### 【0073】

##### 他の既知の薬剤を有する製剤

本発明の化合物および組成物を含む製剤は、前記化合物および組成物と、殺有害生物剤、殺虫剤、殺細菌剤、殺真菌剤、殺ダニ剤、殺微生物剤、殺鼠剤、殺線虫剤、除草剤などを含む、当該技術分野において既知の他の適合性の活性剤とを組み合わせることができる。「殺細菌剤」という用語は、細菌の成長を破壊または阻止し得る物質を指し、「殺真菌剤」は、真菌の成長を破壊または阻止し得る物質を指し、「殺ダニ剤」は、クモ(Arachnida)亜綱のダニ目(Acari)のメンバーの成長を破壊または阻止し得る物質を指し、「殺微生物剤」は、微生物を殺しまたは成長を阻止し得る物質を指し、「殺鼠剤」は、齧歯動物を殺すことができる化学物質を指し、「殺線虫剤」は、線虫の成長を破壊または阻止することができる化学物質を指し、「除草剤」は、植物の成長を破壊または阻止することができる化学物質を指す。

20

#### 【0074】

##### 濃度および組み合わせ

本発明の化合物および組成物は、所望の適用、媒介有害生物、ニューロン活性に対する所望の効果に応じて、そして本発明が適用され得る表面または区域のタイプに応じて種々の濃度で製造または処方され得る。

30

#### 【0075】

所与の組成物における典型的な活性成分は、少なくとも約0.0001重量%の濃度で組成物中に存在し得る。別の実施形態では、活性成分は、約0.001重量%～約0.01重量%、約0.001重量%～約0.02重量%、約0.001重量%～約0.03重量%、約0.001重量%～約0.04重量%、約0.001重量%～約0.05重量%、約0.001重量%～約0.06重量%、約0.001重量%～約0.07重量%、約0.001重量%～約0.08重量%、約0.001重量%～約0.09重量%、約0.001重量%～約0.10重量%、約0.001重量%～約0.11重量%、約0.001重量%～約0.12重量%、約0.001重量%～約0.13重量%、約0.001重量%～約0.14重量%、約0.001重量%～約0.15重量%、約0.001重量%～約0.16重量%、約0.001重量%～約0.17重量%、約0.001重量%～約0.18重量%、約0.001重量%～約0.19重量%、約0.001重量%～約0.20重量%、約0.001重量%～約0.21重量%、約0.001重量%～約0.22重量%、約0.001重量%～約0.23重量%、約0.001重量%～約0.24重量%、約0.001重量%～約0.25重量%、約0.001重量%～約0.26重量%、約0.001重量%～約0.27重量%、約0.001重量%～約0.28重量%、約0

40

50

. 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 2 9 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 0 重量%、約 0 . 0  
 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 1 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 2 重量%、約 0 . 0 0 1  
 重量% ~ 約 0 . 3 3 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 4 重量%、約 0 . 0 0 1 重量  
 % ~ 約 0 . 3 5 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 6 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~  
 約 0 . 3 7 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 3 8 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0  
 . 3 9 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 0 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4  
 1 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 2 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 3 重  
 量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 4 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 5 重量%  
 、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 6 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 7 重量%、約  
 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 8 重量%、約 0 . 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 4 9 重量%、約 0 .  
 0 0 1 重量% ~ 約 0 . 5 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~  
 約 1 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 2 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 2 . 5 重量%、  
 約 0 . 1 重量% ~ 約 3 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 3 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~  
 約 4 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 4 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 5 . 0 重量%、  
 約 0 . 1 重量% ~ 約 5 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 6 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~  
 約 6 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 7 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 7 . 5 重量%、  
 約 0 . 1 重量% ~ 約 8 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 8 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~  
 約 9 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 9 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 0 . 0 重量%  
 、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 0 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 1 . 0 重量%、約 0 . 1 重  
 量% ~ 約 1 1 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 2 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 2  
 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 3 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 3 . 5 重量%、  
 約 0 . 1 重量% ~ 約 1 4 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 4 . 5 重量%、約 0 . 1 重量  
 % ~ 約 1 5 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 5 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 6 .  
 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 6 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 7 . 0 重量%、約  
 0 . 1 重量% ~ 約 1 7 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 8 . 0 重量%、約 0 . 1 重量%  
 ~ 約 1 8 . 5 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 9 . 0 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 1 9 . 5  
 重量%、約 0 . 1 重量% ~ 約 2 0 . 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 5 重量%、約 1 重量% ~ 約  
 1 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 1 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 2 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 2  
 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 3 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 3 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 4 0  
 重量%、約 1 重量% ~ 約 4 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 5 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 5 5 重  
 量%、約 1 重量% ~ 約 6 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 6 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 7 0 重量  
 %、約 1 重量% ~ 約 7 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 8 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 8 5 重量%  
 、約 1 重量% ~ 約 9 0 重量%、約 1 重量% ~ 約 9 5 重量%、約 1 重量% ~ 約 1 0 0 重量%  
 、約 1 0 重量% ~ 約 2 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 3 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 4 0 重  
 量%、約 1 0 重量% ~ 約 5 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 6 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 7  
 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 8 0 重量%、約 1 0 重量% ~ 約 9 0 重量%、または約 1 0 重  
 量% ~ 約 1 0 0 重量%の濃度で存在し得る。さらに、化合物は、種々の実施形態において  
 、本発明の組成物および製剤が、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、  
 13、14、15、16、17、18、19、20またはそれ以上の活性化合物または組  
 成物を含有するように組み合わせられ得る。

【0076】

本明細書において使用される尺度の単位は標準単位およびメートル制を採用する。液体  
 形態で処方または梱包される化合物または組成物が測定される場合、単位は、オンス、カ  
 ップ、ポイント、クォート、ガロン、バーレル、またはその一部の単位であり得ると理解  
 されるべきである。またこれらは、ミリリットル、平方センチメートル、デシリットル、  
 リットル、平方メートルまたはその一部のメートル単位であることもある。

【0077】

固体として処方または梱包される化合物および組成物が測定される場合、単位は、オンス、  
 ポンド、トン、またはその一部の単位を有し得ることは理解されるべきである。また  
 これらは、ミリグラム、グラム、キログラム、メートルトンまたはその一部の単位のこと

10

20

30

40

50

もある。

【0078】

範囲は、本発明の化合物または組成物の適用に応答して媒介有害生物の行動が変更され得る有効な表面または区域に関係する場合、インチ、フィート、平方フィート、ヤード、平方ヤード、エーカー、平方エーカー、またはその一部で表すことができる。またこれらは、ミリメートル、平方ミリメートル、センチメートル、平方センチメートル、メートル、平方メートル、ヘクタール、キロメートル、平方キロメートルまたはその一部の単位のことでもある。

【0079】

適用または処置の方法

本発明の化合物および組成物は、所与の区域において、あるいは個人または構造の近傍において有害生物（例えば、媒介有害生物）の行動を変更するために使用され得る。ヒトおよび非ヒト動物の被験体はこのような使用から恩恵を受けることができる。本明細書で使用される場合、「被験体」という用語は、任意の生命体、ヒトまたは非ヒトを指す。非ヒト動物は、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ウサギ、ウマ、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ブタ、齧歯動物、ニワトリなどを含み得るが、これらに限定されない。

【0080】

本発明の化合物または組成物を所望の物体、個人、表面、区域または領域に適用するために便利であり得る多数の適用方法が当該技術分野において知られている。このような方法には、エアロゾル化、ダスティング、蒸発、霧状化、噴霧、散布、ブロードキャスト、スパックリング (spackling)、スプリング、ペインティング、ブラッシング、コーティング、ローリング、バンディング、側方施肥 (side-dressing)、モッピング (mopping)、ベイジング (bathing)、ソーキング (soaking)、ディッピング、浸漬 (immersing)、粘着、接着、ワイピング、摩擦、含侵、包埋、注射、密封、点在化、ダッピング (dabbing)、ステッピング (stippling)、層状化、ステンシル、スタンプ、注入などが含まれるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、有害生物は、本発明の化合物および/または組成物を含む溶液から引き出される芯 (wick) の表面上またはその周囲において、本発明の化合物および/または組成物に曝露される。

【0081】

適用方法は、間接的な分散方法に依存してもよい。一実施形態では、化合物または組成物は、風、雨、日光、水流などの活発な自然の力によって分散され得る区域に放置され得る。別の実施形態では、本明細書に記載される適用をもたらすために機械装置が使用され得る。さらなる実施形態では、前記機械装置は、化合物または組成物を経時的に表面、区域または基材に適用または分散させるために所定の区域に設置された時限スプレッダーまたはブロードキャスターである。前記機械装置は、本発明の化合物または組成物を適用するために自動化されていてもよいし、あるいは遠隔で始動されてもよい。

【0082】

アッセイおよび試験

本発明の化合物および/または組成物は、このような化合物および/または組成物またはその誘導体の有効性を決定するためのアッセイおよび/または試験と共に開発され得る。いくつかの実施形態では、試験は、有害生物の行動に対する本発明の化合物および/または組成物の効果を決定するために実行される。このような試験は、本発明の化合物および/または組成物が誘引剤または忌避剤の役割を果たす能力を決定するために使用され得る。

【0083】

いくつかの実施形態では、有害生物の行動（例えば、蚊の行動）に対する本発明の化合物および/または組成物の効果を決定するために空間実験が行われる。このような空間実験は、1つまたは複数の空間アリーナの使用を含む。本明細書で使用される場合、「空間アリーナ」という用語は、任意の閉鎖空間を指す。このようなアリーナは、約0.028

10

20

30

40

50

m<sup>3</sup> ( 1 f t<sup>3</sup> ) から約 2 8 3 m<sup>3</sup> ( 約 1 0 , 0 0 0 f t<sup>3</sup> ) の範囲のサイズの大型アリーナ ( セミフィールドチャンパを含むが限定されない ) であり得る。空間アリーナを包囲するために使用される材料は、所望の用途によって様々であり得る。材料は、プラスチックシート、布、ガラス、ネット、木材、石膏ボード、繊維ガラス、網、金属などのうちの 1 つまたは複数を含むことができる。空間アリーナは管理された環境であってもよい。このようなアリーナでは、熱、光、湿度および空気循環の 1 つまたは複数が、実験の変動を制限し、そして / あるいは所与の環境をシミュレートするように管理され得る。空間実験の間に観察され得る有害生物の行動には、所与の薬剤へ向かう動作またはそこから離れる動作、有害生物の動作レベルの変化、不動化、不規則な動作および / または死亡が含まれるが、これらに限定されない。

10

**【 0 0 8 4 】**

いくつかの実施形態では、本発明の化合物および / または組成物を試験するためにフィールド試験が実行される。本明細書で使用される場合、「フィールド試験」という用語は、1 つまたは複数の天然環境で行われる試験を指す。フィールド試験はトラップを使用して、トラップ場所で、その中で、またはその周囲において有害生物を採取し、そして / あるいは有害生物の数を記録することができる。本明細書で使用される場合、「トラップ」という用語は、1 つまたは複数の有害生物を誘引、捕獲および / または殺すために使用される任意のデバイスおよび / または物体を指す。トラップは天然のものでも人工のものでもよい。いくつかの実施形態では、本発明のトラップは受動トラップであり得る。本明細書で使用される場合、「受動トラップ」という用語は、有害生物がトラップの近くへ移動することに依存する固定トラップを指す。このようなトラップは、リッチー ( R i t c h i e ) ら ( リッチー ( R i t c h i e ) , S . A . ら著、「アルボウイルス調査のための蚊の採取用の簡単な電力供給のない受動トラップ ( A s i m p l e n o n - p o w e r e d p a s s i v e t r a p f o r t h e c o l l e c t i o n o f m o s q u i t o e s f o r A r b o v i r u s s u r v e i l l a n c e ) 」、ジャーナル・オブ・メディカル・エントモロジー ( J o u r n a l o f M e d i c a l E n t o m o l o g y ) 、2 0 1 3 年、第 5 0 ( 1 ) 巻、p . 1 8 5 ~ 9 4 ) によって記載されるものが含まれる。いくつかの実施形態では、受動トラップは移動メカニズムを持たず、有害生物を動けなくするため、および / またはトラップ区域からのその逃亡を防止するための固定トラップ部品に依存し得る。いくつかの実施形態では、トラップは、トラップに誘引された有害生物を捕集するための容器 ( 例えば、箱、筒など ) を含み得る。いくつかの実施形態では、トラップは、有害生物をトラップに誘引するための誘惑物または餌を含み得る。このような誘惑物は、その中に提供された化合物および / または組成物を含み得る。

20

30

**【 0 0 8 5 】**

いくつかの実施形態では、トラップは致死的なトラップであり得る。本明細書で使用される場合、「致死的なトラップ」という用語は、このようなトラップによって捕獲された 1 つまたは複数の有害生物を殺すトラップを指す。このようなトラップは、1 つまたは複数の有害生物に曝露される ( 例えば、摂取、吸入など ) と致死的であり得る 1 つまたは複数の毒性化合物を含み得る。いくつかの実施形態では、致死的なトラップは、不動化 ( 例えば、移動および / または活力に必要な栄養源の制限 ) によって捕獲された有害生物を殺す。

40

**【 0 0 8 6 】****キットおよびデバイス**

本発明の化合物、組成物および組み合わせは他の材料または試薬と組み合わせられてもよいし、あるいは商業的な販売または流通のためのキットまたは他の小売用製品の構成要素として調製されてもよい。これらのキットおよびまたは製剤は、本明細書に開示される方法に従って一般使用のためにこれらの小売用製品を販売する目的で小売業者に販売され得る。従って、本発明は、最終使用者に提供されるキットおよびまたは製品の製造または生産方法を包含する。キットは、化合物、組成物または組み合わせを含む包装、バイアル

50

または容器と、任意選択で使用説明書とを含有し得る。

【0087】

本発明の化合物、組成物および装置は、キットとして、その後の個人または最終使用者による構築、希釈または他の再構成の方法のためのモジュール形式で販売され得る。前記キットには、活性組成物、製剤または装置の構築に必要な構成要素が全て完備され得る。別の実施形態では、前記キットは必要な構成要素の一部を提供し、その後の使用者または最終使用者が1つまたは複数の構成要素（例えば、希釈、再水和などのための水または他の溶媒など）を別に提供することを必要とする。

【0088】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物および/または組成物は、このような化合物および/または組成物を収納する、含有する、および/またはその拡散を容易にするためのデバイスと共に使用され得る。このようなデバイスは、装飾台、ボール、スティック（このようなスティックはセルロース、プラスチック、木材、紙などを含み得るが限定されない材料で構成される）、コイル、塗料、布帛、パッチ、ウシ/動物耳標、蚊帳、注入処理されたプラスチック、噴霧器、ろうそく、ランタン、ランプ、クリップ留め式デバイスおよびプラグイン式デバイス（空気拡散器の有無にかかわらず）を含み得る。このようなデバイスは、液体状および/または固体状の形態の本発明の化合物および/または組成物を含み得る。いくつかの実施形態では、このようなデバイスは詰替え可能であり得る。

10

【0089】

パッチ

20

いくつかの実施形態では、本発明の化合物を含む製剤はパッチ内に適用または包含され得る。本明細書で使用される場合、「パッチ」という用語は、材料の小片を指す。パッチは、本発明の化合物および/または組成物を保持する基材の役割を果たし得る。本発明の製剤が適用または注入されたパッチは、いくつかの実施形態では、このようなパッチから所定の範囲内に来る媒介有害生物の行動を変更するために使用され、空間的な忌避の役割を果たすことができる。本発明の化合物および/または組成物は、液体形式または製剤でパッチに適用され得る。場合によっては、パッチは、このような液体製剤がまだ湿ったままの状態で使用され、他の実施形態では、液体製剤は乾燥される。本発明のパッチは、紙、プラスチック、金属、布帛、ワックス、高分子材料、ポリエチレン、ポリプロピレン、ゴム、セルロース、シリコンゴムおよび/またはセルロースベースの材料を含むがこれら

30

【0090】

パッチは種々のサイズおよび形状を有し得る。いくつかの実施形態では、パッチは平坦であり、約 $1\text{ cm}^2$ ～約 $5\text{ cm}^2$ 、約 $2\text{ cm}^2$ ～約 $10\text{ cm}^2$ 、約 $3\text{ cm}^2$ ～約 $15\text{ cm}^2$ 、約 $4\text{ cm}^2$ ～約 $20\text{ cm}^2$ 、約 $12\text{ cm}^2$ ～約 $48\text{ cm}^2$ 、約 $24\text{ cm}^2$ ～約 $72\text{ cm}^2$ 、約 $50\text{ cm}^2$ ～約 $100\text{ cm}^2$ または少なくとも $100\text{ cm}^2$ の面積を含む。パッチ形状は、円形、正方形、矩形、三角形および多角形を含み得るが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、パッチは、辺の長さが約 $1.5\text{ cm}$ の正方形である。さらに、パッチは、任意の色およびまたはパターンを含み得る。パッチ色の非限定的な例としては、赤、オレンジ、黄緑、青、紫、藍色、すみれ色、黒、白、蛍光などが挙げられる。パッチパターンの非限定的な例としては、縞、格子縞、水玉模様、斑点、小斑点、迷彩などが挙げられる。

40

【0091】

パッチは、当業者に知られている任意の方法に従って被験体に適用され得る。このような方法には、被験体の皮膚、衣類または衣服（例えば、付属品、帽子、リュックサック、スカーフ、手袋、靴、サングラス、イヤリングなど）への直接適用が含まれ得るが、これらに限定されない。パッチは、接着剤（例えば、にかわ、ペースト、ゲル、樹脂、ガム、エポキシなど）、静電気相互作用、テープ、バンディング（例えば、手首、脚および/またはウェスト（waste）バンドを用いる取付け具など）によって、あるいは当該技術

50

分野において既知の他の方法によって、このような皮膚、衣類または衣服に取り付けられ得る。使用され得るいくつかの接着剤は、耐水性または防水性の接着剤であり得る。いくつかのパッチは、パッチ接着剤を保護するためにフィルムまたは紙の層を含む。いくつかのフィルムまたは紙の層は、このようなパッチの適用前に剥がすことができる。

#### 【0092】

いくつかの実施形態では、パッチは、ホルダーの内側に配置されてもよいし、あるいはホルダーに取り付けられてもよい。本明細書で使用される場合、「ホルダー」という用語は、パッチを収納および/または把持するために使用される容器またはデバイスを指す。ホルダーは、ポケット、コンパートメント、カセット、ボックス、クリップ、またはパッチを収納もしくは結合するために使用され得る他のこのようなデバイスを含み得る。いくつかのホルダーは、金属、プラスチック、弾性ゴム、メッシュ、スクリーン、布帛および/または木材を含むがこれら限定されない材料を含み得る。ホルダーは、家庭または屋外での使用に適合するように様々なサイズであり得る。

10

#### 【0093】

いくつかのパッチおよび/またはホルダーは、付属デバイスを用いて被験体に取り付けることができる。本明細書で使用される場合、「付属デバイス」という用語は、第1のデバイスに関して二次的に重要なデバイスを指す。いくつかの実施形態では、付属デバイスは、パッチおよび/またはホルダーを被験体に取り付けるために着用される物を含み得る。このような付属デバイスは、ブレスレット、ネックレス、リストバンド、首輪、アームバンド、衣類、布帛および/またはクリップ留め式デバイスを含み得るが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、付属デバイスは空気拡散器を含み得る。本明細書で使用される場合、「空気拡散器」という用語は、空気を循環させて、エアロゾルの散布および/または散逸を可能にするデバイスを指す。このような空気拡散器は電力供給（例えば、電池式、太陽電池式など）されていてもよいし、電力供給されていなくてもよい。いくつかの空気拡散器は送風機を含み得る。空気拡散器は、パッチ内に含まれる化合物および/または組成物を分散させて、より大きい保護ゾーンを作り出すために使用され得る。

20

#### 【0094】

いくつかの実施形態では、パッチは、ネコ、ブタ、イヌ、ウマおよびウシを含むがこれらに限定されない非ヒト動物の被験体を保護するために使用され得る。パッチは、付属デバイス（その非限定的な例としては、首輪またはバンドが挙げられる）によってこのような動物に取り付けられ得る。他の実施形態では、パッチは、このような動物の首または体の他の部分の周りに着用されるホルダー内に配置される。

30

#### 【0095】

##### トラップ

いくつかの実施形態では、本発明の化合物および/または組成物は、トラップの一部として使用され得る。いくつかの実施形態では、本発明の化合物および/または組成物は、有害生物をトラップに誘い出すために、誘引剤として、そして/あるいは他の誘引剤と組み合わせて使用され得る。いくつかの実施形態では、本発明の化合物および/または組成物は、トラップおよび/またはトラップの中、上、または周囲に存在する餌もしくは誘惑物に密集している昆虫を防除するために、殺生物剤として使用され得る。

40

#### 【0096】

##### 等価物および範囲

当業者は本明細書に記載される本発明に従う特定の実施形態の多くの等価物を認識するであろうし、あるいは単なる日常的な実験法を用いて確かめることができるであろう。本発明の範囲は、上記の説明に限定されることは意図されず、むしろ添付の特許請求の範囲に記載される通りである。

#### 【0097】

特許請求の範囲において、「1つの」および「前記」などの冠詞は、そうでないことが示されない限り、あるいは文脈から明らかでない限り、1つ以上を意味することがある。群の中の1つまたは複数のメンバーの間に「または」を含む請求項または説明は、そうで

50

ないことが示されない限り、あるいは文脈から明らかでない限り、その群のメンバーの1つ、2つ以上、または全てが、所与の製品またはプロセス中に存在するか、これらにおいて使用されるか、あるいは何らかの形でこれらに関連する場合に該当すると考えられる。本発明は、その群の厳密に1つのメンバーが、所与の製品またはプロセス中に存在するか、これらにおいて使用されるか、あるいは何らかの形でこれらに関連する実施形態を含む。本発明は、その群のメンバーの2つ以上、または全てが、所与の製品またはプロセス中に存在するか、これらにおいて使用されるか、あるいは何らかの形でこれらに関連する実施形態を含む。

【0098】

また、「含む」という用語は非制限的であることが意図され、付加的な要素またはステップの包含を容認するが要求はしないことを注記しておく。従って、「含む」という用語が本明細書において使用される場合、「からなる」という用語も包含および開示される。

10

【0099】

範囲が与えられる場合、端点が含まれる。さらに、他に記載されない限り、あるいは他の形で文脈および当業者の理解から明らかでない限り、範囲として表される値は、文脈がそうでないことを明らかに規定しない限り、その範囲の下限の単位の10分の1まで、本発明の種々の実施形態において記述される範囲内の任意の特定の値または部分範囲をとることができることと理解されるべきである。

【0100】

「約」という用語が使用される場合、詳述される値の+/-10%を表すものと理解される。

20

さらに、従来技術の範囲内に入る本発明の任意の特定の実施形態が、請求項の任意の1つまたは複数から明確に除外され得ることは理解されるべきである。このような実施形態は当業者に既知であると見なされるので、たとえ除外が本明細書に明確に記載されていなくてもこれらは除外され得る。本発明の組成物の任意の特定の実施形態（例えば、任意の核酸またはそれがコードするタンパク質；任意の製造方法；任意の使用方法など）は、従来技術の存在に関連しているか否かにかかわらず、任意の理由により請求項の任意の1つまたは複数から除外され得る。

【0101】

引用される全ての情報源、例えば、参考文献、公報、データベース、データベースエントリ、およびそこで引用される技術は、引用の際に明確に記述されていなくても、参照によって本出願に援用される。引用される情報源および本出願の記述が矛盾する場合には、本出願の記述が支配するものとする。

30

【0102】

節および表の見出しは限定的であることを意図しない。

実施例

実施例1．感覚ニューロン調節因子活性化剤の同定

蚊の二酸化炭素受容体ニューロンは、二酸化炭素レベルに対する感知および応答の原因である。蚊種のアエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) において、小顎鬚のcpAニューロンは主要なCO<sub>2</sub>センサーであるが、cpAニューロンと同時にその活性が可視化され得るcpBおよびcpCニューロンは、皮膚の臭気に対しても応答性である(ルー(Lu)、T.ら著、「マラリア媒介生物の蚊アノフェレス・ガンビアエ (*Anopheles gambiae*) の小顎鬚における臭気コーディング (Odor coding in the maxillary palp of the malaria vector mosquito *Anopheles gambiae*)」、カレント・バイオロジー (Curr Biol)、2007年9月、第18; 17(18)巻、p. 1533~44、Epub 2007年8月30日)。

40

【0103】

感覚ニューロンに対する影響を有する化合物を同定するために、ドブリツァ (Dobritsa) により2003年に記載され (ドブリツァ (Dobritsa), A. A.

50

ら著、「ドロソフィラ (*Drosophila*) 触覚における臭気コーディングの分子および細胞基盤の統合 (Integrating the molecular and cellular basis of odor coding in the *Drosophila* antenna)」、ニューロン (*Neuron*)、2003年3月6日、第37(5)巻、p. 827~41)、ターナー (Turner) らにより2011年に修正された (ターナー (Turner), S. L. ら著、「CO<sub>2</sub> 感受性ニューロンの超持続的な活性化が蚊を混乱させる (Ultra-prolonged activation of CO<sub>2</sub>-sensing neurons disorients mosquitoes)」、ネイチャー (*Nature*)、2011年6月2日、第474(7349)巻、p. 87~91) ように、細胞外単一感覚子の電気生理学を実施して、種々の化合物および組成物に対する cpA ニューロンの応答を試験した。この目的のために、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロンにおける蚊ニューロン活性を刺激するその能力について種々の化合物および組成物を試験した。臭気送達システムからの空気の流れに沿って蚊を固定および配置した。このシステムでは、加湿空気の定常流を制御された最低レベルの CO<sub>2</sub> ガスと共に保持した。加湿空気流は、精製空気タンクから 10 ml / 秒で送達した。CO<sub>2</sub> ガスは、制御されたパルス (2.5 ml / 秒 ~ 6.5 ml / 秒) を加湿空気流に送達することができる別のシステムによって提供した。CO<sub>2</sub> のレベルは、1% と 100% の間で CO<sub>2</sub> 圧縮空気源を切り替えることによって操作した。さらに、臭気送達システムは、所望の化学物質または化学組成物からの蒸気を含む、制御されたレベルの空気を送達するように設計した。

10

20

#### 【0104】

種々の化学物質の刺激に対する cpA ニューロンの応答を試験するために、ターナー (Turner) により2009年に記載された (ターナー (Turner), S. L. ら著、「阻害性臭気物質によるドロソフィラ (*Drosophila*) における CO<sub>2</sub> 回避行動の変更 (Modification of CO<sub>2</sub> avoidance behaviour in *Drosophila* by inhibitory odorants)」、ネイチャー (*Nature*)、2009年9月10日、第461(7261)巻、p. 277~81. Epub 2009年8月26日) ように、高度に精製された化学物質または化学組成物を、パラフィン油を含む試験溶液中に希釈し、溶液を受け入れるための脱脂綿挿入物と共にパストールピペットを含むカートリッジへ適用した。ひと吹き (puff) 毎に制御容積 (5 ml / 秒) で臭気カートリッジにより空気を精製し、蚊の上を流れる一定の加湿空気流へ蒸気を送達した。

30

#### 【0105】

ニューロンの応答を検出するために、ドブリツァ (Dobritsa) らにより2003年に記載され (ドブリツァ (Dobritsa), A. A. ら著、「ドロソフィラ (*Drosophila*) 触覚における臭気コーディングの分子および細胞基盤の統合 (Integrating the molecular and cellular basis of odor coding in the *Drosophila* antenna)」、ニューロン (*Neuron*)、2003年3月6日、第37(5)巻、p. 827~41)、ターナー (Turner) らにより2011年に記載のように修正された (ターナー (Turner), S. L. ら著、「CO<sub>2</sub> 感受性ニューロンの超持続的な活性化が蚊を混乱させる (Ultra-prolonged activation of CO<sub>2</sub>-sensing neurons disorients mosquitoes)」、ネイチャー (*Nature*)、2011年6月2日、第474(7349)巻、p. 87~91) ように、細胞外単一感覚子の電気生理学を実施した。

40

#### 【0106】

この方法に続いて、感覚子の壁を通して電極を挿入し、樹状細胞を取り巻く関連するリンパ液と接触させることによって、ニューロンの活動電位を検出および記録した。記録電極は、1マイクロメートル未満の直径まで引き延ばした先端を有するガラス毛細管で構成した。毛細管に、感覚子リンパのリンゲル溶液 (0.4% グルコース、1.3% KCl、

50

0.1%  $\text{KH}_2\text{PO}_4$ 、0.2%  $\text{K}_2\text{HPO}_4$ 、0.06%  $\text{MgCl}_2$ 、0.01%  $\text{CaCl}_2$  および 0.0001%  $\text{HCl}$ 、 $\text{pH} 6.5$ ) を満たし、 $\text{AgCl}$  被覆銀ワイヤ上に配置した。第2の不関電極にも感覚子リンパ液のリングル溶液を満たし、蚊の眼に入れた。得られたインパルスシグナルを増幅し、フィルターにかけて、感覚子における異なるニューロンのニューロン活性をインパルス振幅によって単離した後の痕跡のみを分析した。

#### 【0107】

本明細書において1秒当たりの「スパイク」(spk/秒)と呼ばれるインパルスの数を、提供される刺激に応答するニューロン活性の指標として記録した。刺激時に記録されたレベルをベースライン活性値から差し引くことによって最終活性化値を得た。この方法を用いて得られた結果の一例として、図1は、電気生理学を用いて試験された化学物質の溶媒であるパラフィン油による $\text{CO}_2$ 受容体の基礎活性(上部パネル)を、1%濃度の阻害剤2-メトキシ-3-メチルピリジン(中央パネル)、および活性化剤2,4-ルチジン(下部パネル)と比較して説明する。2-メトキシ-3-メチルピリジンは香料の使用が認可されており、「ナッツ」臭を有する。2,4-ルチジンは「グリーン」臭を有し、化粧品香料の使用が認可されており、フレーバー・アンド・エキストラクト・マニュファクチャラーズ・アソシエーション(FEMA)によって「一般に安全と認められる」(GRAS)化合物として記載されている。

10

#### 【0108】

##### 実施例2. 活性化剤化合物の同定

実施例1において概説された実験に続いて、一連の化合物を、cpAニューロン活性を活性化する能力について試験した。これらの化合物のリストは表6に提供される。化合物はその活性化剤としての強度に従って分類され、強力な活性化剤はベースラインニューロン活性と比べて60spk/秒を超える活性の増大をもたらす。中程度の活性化剤は、ベースラインニューロン活性と比べて40~60spk/秒の間であるニューロン活性の増大をもたらす。最後に、穏やかな活性化剤はベースラインニューロン活性と比べて20~40spk/秒の間であるニューロン活性の増大をもたらす。

20

#### 【0109】

【表 6 - 1】

表 6. 活性化剤化合物

| 化合物番号   | 化合物  | 分類       |
|---------|--|----------|
| OLI0001 | 2,4-ルチジン                                     | 強力な活性化剤  |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン                                    | 強力な活性化剤  |
| OLI0003 | 2-メトキシピラジン                                   | 強力な活性化剤  |
| OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン                          | 強力な活性化剤  |
| OLI0005 | 4-エチルフェノール                                   | 強力な活性化剤  |
| OLI0006 | 5-メチルフルフラール                                  | 強力な活性化剤  |
| OLI0007 | ギ酸ブチル  | 強力な活性化剤  |
| OLI0008 | シクロペンタノン                                     | 強力な活性化剤  |
| OLI0009 | 2-フロ酸エチル                                     | 強力な活性化剤  |
| OLI0010 | 乳酸エチル  | 強力な活性化剤  |
| OLI0011 | エチルビニルカルビノール                                 | 強力な活性化剤  |
| OLI0012 | グアヤコール                                       | 強力な活性化剤  |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブテナール                           | 強力な活性化剤  |
| OLI0014 | 2,3,5-トリメチルピラジン                              | 中程度の活性化剤 |
| OLI0015 | 2,3-ジメチルピラジン                                 | 中程度の活性化剤 |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン                              | 中程度の活性化剤 |
| OLI0017 | 2-フリルメチルケトン                                  | 中程度の活性化剤 |
| OLI0018 | 2-ペンタノン                                      | 中程度の活性化剤 |
| OLI0019 | 酪酸アリル  | 中程度の活性化剤 |
| OLI0020 | シンナミルニトリル                                    | 中程度の活性化剤 |
| OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサノ酸エチル                              | 中程度の活性化剤 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル                                     | 中程度の活性化剤 |
| OLI0023 | エチルビニルケトン                                    | 中程度の活性化剤 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン                                  | 中程度の活性化剤 |
| OLI0025 | メタンチオールアセタート                                 | 中程度の活性化剤 |
| OLI0026 | クロトン酸メチル                                     | 中程度の活性化剤 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル                                     | 中程度の活性化剤 |
| OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド                                 | 中程度の活性化剤 |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド                                | 中程度の活性化剤 |
| OLI0030 | 2,4-ジメチルベンズアルデヒド                             | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0031 | 2,4-ジメチル-3-シクロヘキセン-カルボキシアルデヒド(シス/トランス形態の混合物) | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0032 | 2-エチル-5(6)-メチルピラジン                           | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0033 | 2-メトキシ-4-メチルフェノール                            | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0034 | 2-フェニルプロピオンアルデヒド                             | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0035 | 3-ヘキサノン                                      | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0036 | 4-エチルベンズアルデヒド                                | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0037 | 4-オキソイソホロン                                   | 穏やかな活性化剤 |

10

20

30

40

【表 6 - 2】

|         |                          |          |
|---------|--------------------------|----------|
| OLI0038 | アセチル-2-ピラジン              | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0039 | ブタン酸ブタン-3-オン-2 イル        | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0040 | コハク酸ジメチル                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0041 | ジプロピレングリコール-モノメチルエーテル    | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0042 | 3-ヒドロキシ酪酸エチル             | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0043 | エチル-2, 3, 5 (6)-ジメチルピラジン | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0044 | ギ酸エチル                    | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0045 | イソ酪酸エチル                  | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0046 | イソ吉草酸エチル                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0047 | レブリン酸エチル                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0048 | フルフリルエチルエーテル             | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0049 | ヘプトアルデヒド                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0050 | ヘプタノン-4                  | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0051 | ヘキサナール                   | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0052 | インドール                    | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0053 | 酢酸イソブチル                  | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0054 | プロピオン酸イソブチル              | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0055 | トランス-2-ブテン酸イソブチル         | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0056 | 酪酸イソプロピル                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0057 | チグリン酸イソプロピル              | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0058 | イソ吉草酸メチル                 | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0059 | メチルヘプタジエノン               | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0060 | m-トルアルデヒド                | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0061 | o-アニスアルデヒド               | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0062 | 酢酸プレニル                   | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0063 | ギ酸プロピル                   | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0064 | R+ プレゴン                  | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0065 | トランス-シナムアルデヒド            | 穏やかな活性化剤 |
| OLI0066 | バレルアルデヒド                 | 穏やかな活性化剤 |

### 実施例 3 . 非常に強力な活性化剤の組み合わせの同定

実施例 1 において概説された実験に従って、一連の組み合わせを、c p A ニューロン活性を活性化する能力について試験した。表 7 は、様々な組み合わせを臭気送達システムに導入した後に得られたニューロン活性値 ( s p k / 秒 ) を示す。試験した組み合わせは、試験溶液中 1 % の成分 A および 1 % の成分 B で構成した。これらの組み合わせのそれぞれは、1 0 0 s p k / 秒を超えるニューロン活性値をもたらした。従って、これらの組み合わせは、非常に強力な活性化剤であると考えられる。多くの場合、2 つの成分または化合物の組み合わせは、いずれかの化合物単独の活性よりも大きい活性を生じた。この場合、組み合わせは相乗的であると考えた。表中、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指す。

【 0 1 1 1 】

【表 7 - 1】

表 7. 非常に強力な活性化剤の組み合わせ

| Cmpd No. | 成分 A           | Cmpd No. | 成分 B                | Act (spk/秒) |
|----------|----------------|----------|---------------------|-------------|
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 110         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 119         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0003  | 2-メトキシピラジン          | 113         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 124         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0007  | ギ酸ブチル               | 101         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0008  | シクロペンタノン            | 143         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0010  | 乳酸エチル               | 159         |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール    | OLI0011  | エチルビニルカルビノール        | 135         |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン    | OLI0020  | シンナミルニトリル           | 115         |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン    | OLI0022  | アセト酢酸エチル            | 112         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 136         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 156         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0003  | 2-メトキシピラジン          | 156         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 151         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0022  | アセト酢酸エチル            | 151         |
| OLI0008  | シクロペンタノン       | OLI0011  | エチルビニルカルビノール        | 144         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 162         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 154         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0003  | 2-メトキシピラジン          | 167         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 164         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0007  | ギ酸ブチル               | 110         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0008  | シクロペンタノン            | 163         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0011  | エチルビニルカルビノール        | 156         |
| OLI0010  | 乳酸エチル          | OLI0013  | トランス-2-メチル-2-ブテナール  | 126         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 119         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 118         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0003  | 2-メトキシピラジン          | 108         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 131         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0008  | シクロペンタノン            | 146         |
| OLI0007  | ギ酸ブチル          | OLI0011  | エチルビニルカルビノール        | 110         |
| OLI0013  | トランス-2-メチル-2-ブ | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 112         |

【 0 1 1 2 】

10

20

30

40

【表 7 - 2】

|         |                        |         |                         |     |
|---------|------------------------|---------|-------------------------|-----|
|         | テナール                   |         |                         |     |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブ<br>テナール | OLI0002 | 2-エチルピラジン               | 127 |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブ<br>テナール | OLI0003 | 2-メトキシピラジン              | 126 |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブ<br>テナール | OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラ<br>ン-3-オン | 148 |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブ<br>テナール | OLI0008 | シクロペンタノン                | 165 |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブ<br>テナール | OLI0011 | エチルビニルカルビノール            | 128 |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン              | OLI0001 | 2,4-ルチジン                | 118 |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン              | OLI0003 | 2-メトキシピラジン              | 121 |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン              | OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラ<br>ン-3-オン | 134 |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン              | OLI0011 | エチルビニルカルビノール            | 122 |
| OLI0003 | 2-メトキシピラジン             | OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラ<br>ン-3-オン | 134 |
| OLI0003 | 2-メトキシピラジン             | OLI0011 | エチルビニルカルビノール            | 146 |
| OLI0015 | 2,3-ジメチルピラジン           | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン             | 102 |
| OLI0011 | エチルビニルカルビノール           | OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラ<br>ン-3-オン | 124 |
| OLI0096 | ギ酸シス-3-ヘキセニル           | OLI0017 | 2-フリルメチルケトン             | 147 |
| OLI0099 | プロピオン酸イソアミル            | OLI0017 | 2-フリルメチルケトン             | 118 |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル                 | OLI0017 | 2-フリルメチルケトン             | 115 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0025 | メタンチオールアセタート            | 160 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン             | 158 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0022 | アセト酢酸エチル                | 144 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ酸エ<br>チル      | 126 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0018 | 2-ペンタノン                 | 125 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル               | OLI0014 | 2,3,5-トリメチルピラジン         | 107 |

#### 実施例 4 . 強力な活性化剤の組み合わせの同定

実施例 1 において概説された実験に従い、電気生理学的な細胞外単一感覚子研究において、一連の組み合わせ（表 8 に記載）を、c p A ニューロン活性を活性化する能力について試験した。これらの組み合わせを、1%の成分 A および 1%の成分 B の濃度で試験溶液に添加した。表中の組み合わせのそれぞれは、60 ~ 100 s p k / 秒の間の活性値をもたらした。従って、これらは強力な活性化剤であると考えられる。2つの成分または化合物の組み合わせが、いずれかの化合物単独の活性よりも大きい活性を生じる場合、その組み合わせは相乗的であると考えた。表中、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指す。

【 0 1 1 3 】

【表 8 - 1】

表 8. 強力な活性化剤の組み合わせ

| Cmpd No. | 成分 A              | Cmpd No. | 成分 B               | Act (spk/秒) |
|----------|-------------------|----------|--------------------|-------------|
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | OLI0018  | 2-ペンタノン            | 63          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 71          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド       | 67          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン  | 92          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | OLI0019  | 酪酸アリル              | 61          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル    | 65          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド       | 77          |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン  | 78          |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル    | 60          |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 92          |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 64          |
| OLI0006  | 5-メチルフルフラール       | OLI0013  | トランス-2-メチル-2-ブテナール | 99          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン  | 91          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン      | 78          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン    | 60          |
| OLI0092  | メチルアミルケトン         | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン        | 75          |
| OLI0092  | メチルアミルケトン         | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 60          |
| OLI0020  | シンナミルニトリル         | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン  | 62          |
| OLI0020  | シンナミルニトリル         | OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン      | 62          |
| OLI0020  | シンナミルニトリル         | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 77          |
| OLI0020  | シンナミルニトリル         | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 64          |
| OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル   | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド       | 62          |
| OLI0022  | アセト酢酸エチル          | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン  | 76          |
| OLI0022  | アセト酢酸エチル          | OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン      | 67          |

【 0 1 1 4 】

10

20

30

40

【表 8 - 2】

|         |                  |         |                   |    |    |
|---------|------------------|---------|-------------------|----|----|
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン   | 65 |    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0018 | 2-ペンタノン           | 62 |    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0020 | シンナミルニトリル         | 63 |    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル   | 68 |    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | 87 |    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド      | 60 | 10 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン      | OLI0018 | 2-ペンタノン           | 70 |    |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン      | OLI0019 | 酪酸アリル             | 73 |    |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン      | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル   | 75 |    |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン      | OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド      | 69 |    |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン      | OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド     | 64 |    |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | 77 | 20 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン   | 77 |    |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | 82 |    |
| OLI0098 | ギ酸イソアミル          | OLI0017 | 2-フリルメチルケトン       | 83 |    |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル           | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | 82 |    |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル           | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | 75 |    |
| OLI0096 | ギ酸シス-3-ヘキセニル     | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | 72 | 30 |
| OLI0098 | ギ酸イソアミル          | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | 69 |    |
| OLI0099 | プロピオン酸イソアミル      | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | 69 |    |
| OLI0098 | ギ酸イソアミル          | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | 63 |    |
| OLI0098 | ギ酸イソアミル          | OLI0022 | アセト酢酸エチル          | 63 |    |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         | OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジン     | 97 |    |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         | OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド     | 96 |    |
| OLI0008 | シクロペンタノン         | OLI0063 | ギ酸プロピル            | 92 |    |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         | OLI0026 | クロトン酸メチル          | 92 | 40 |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル         | OLI0025 | メタンチオールアセタート      | 89 |    |
| OLI0018 | 2-ペンタノン          | OLI0063 | ギ酸プロピル            | 80 |    |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         | OLI0019 | 酪酸アリル             | 78 |    |
| OLI0027 | レブリン酸メチル         | OLI0020 | シンナミルニトリル         | 70 |    |

実施例 5 . 相乗的な組み合わせの同定

実施例 1 において概説された実験に従って、表 9 に記載される組み合わせも電気生理学的な細胞外単一感覚子研究において使用した。これらの組み合わせを、1%の成分 A および 1%の成分 B の濃度で試験溶液に添加した。

【 0 1 1 5 】

10

20

30

40

50

個々の成分は、個々に試験したときに、中程度の活性（中程度の活性化剤の分類、40～60 spk/秒）や、穏やかな活性（穏やかな活性化剤の分類、20～40 spk/秒）しか生じないか、あるいはcpBおよびcpCニューロンを刺激することだけが知られている（ベータ活性化剤の分類）ものであった。驚くべきことに、表9に記載されるように組み合わせると、成分は相乗的に作用してニューロン活性を刺激し、60 spk/秒を超える活性値をもたらす。

【0116】

試験したいくつかの組み合わせは、穏やかな阻害剤ヘプタン酸メチルまたはメチルアミルケトンを含む。予想外なことに、メチルアミルケトンおよび2-フリルメチルケトンまたはガンマ-ヘブタラクトンを含む組成物は、ニューロン活性の強力な活性化剤の機能を果たした。同様に、ヘプタン酸メチルおよびメタンチオールアセタートを含む組成物も、ニューロン活性の強力な活性化剤の機能を果たした。表中、「Act」は活性を指し、「Compd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指し、「Mod」は中程度を指し、「Inh」は阻害剤を指し、「Activ」は活性化剤を指す。

【0117】

【表 9 - 1】

表 9. 強力または非常に強力な活性をもたらす相乗的な組み合わせ

| Cmpd No. | Comp A            | Comp A 分類   | Cmpd No. | Comp B            | 成分 B 分類     | Act (spk/秒) |
|----------|-------------------|-------------|----------|-------------------|-------------|-------------|
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | OLI0018  | 2-ペンタノン           | Mod<br>Actv | 63          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | OLI0020  | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 62          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod<br>Actv | 71          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル  | ベータ<br>Actv | 77          |
| OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド      | Mod<br>Actv | 67          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | 92          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0019  | 酪酸アリル             | Mod<br>Actv | 61          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0020  | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 62          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル   | Mod<br>Actv | 65          |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod<br>Actv | 102         |
| OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド      | Mod<br>Actv | 77          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | 91          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | 78          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | Mod<br>Actv | 60          |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0020  | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 115         |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0022  | アセト酢酸エチル          | Mod<br>Actv | 112         |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod<br>Actv | OLI0092  | メチルアミルケトン         | 穏やかな<br>Inh | 75          |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | Mod<br>Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | 78          |

10

20

30

40

【表 9 - 2】

|         |                 |             |         |                   |             |    |
|---------|-----------------|-------------|---------|-------------------|-------------|----|
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン | Mod<br>Actv | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ酸エチル    | Mod<br>Actv | 60 |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン | Mod<br>Actv | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod<br>Actv | 92 |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン | Mod<br>Actv | OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル  | ベータ<br>Actv | 77 |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン | Mod<br>Actv | OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド     | Mod<br>Actv | 64 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod<br>Actv | 76 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod<br>Actv | 67 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン   | Mod<br>Actv | 65 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0018 | 2-ペンタノン           | Mod<br>Actv | 62 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0020 | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 63 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ酸エチル    | Mod<br>Actv | 68 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod<br>Actv | 87 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル        | Mod<br>Actv | OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド      | Mod<br>Actv | 60 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0018 | 2-ペンタノン           | Mod<br>Actv | 70 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0019 | 酪酸アリル             | Mod<br>Actv | 73 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0020 | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 77 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ酸エチル    | Mod<br>Actv | 75 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル  | ベータ<br>Actv | 82 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0092 | メチルアミルケトン         | 穏やかな<br>Inh | 60 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド     | Mod<br>Actv | 64 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン     | Mod<br>Actv | OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド      | Mod<br>Actv | 69 |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド   | Mod<br>Actv | OLI0020 | シンナミルニトリル         | Mod<br>Actv | 64 |

【表 9 - 3】

|         |                     |             |         |                       |              |     |
|---------|---------------------|-------------|---------|-----------------------|--------------|-----|
| OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ<br>ン酸エチル | Mod<br>Actv | OLI0028 | フェニルアセトアルデ<br>ヒド      | Mod<br>Actv  | 62  |
| OLI0018 | 2-ペンタノン             | Mod<br>Actv | OLI0063 | ギ酸プロピル                | 穏やかな<br>Actv | 80  |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル            | 穏やかな<br>Inh | OLI0025 | メタンチオールアセタ<br>ート      | Mod<br>Actv  | 89  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0020 | シンナミルニトリル             | Mod<br>Actv  | 70  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0029 | フェニルプロピルアル<br>デヒド     | Mod<br>Actv  | 96  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジ<br>ン     | Mod<br>Actv  | 97  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0026 | クロトン酸メチル              | Mod<br>Actv  | 92  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0019 | 酪酸アリル                 | Mod<br>Actv  | 78  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラ<br>ジン | Mod<br>Actv  | 107 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0022 | アセト酢酸エチル              | Mod<br>Actv  | 144 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0025 | メタンチオールアセタ<br>ート      | Mod<br>Actv  | 160 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ<br>ン酸エチル   | Mod<br>Actv  | 126 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン           | Mod<br>Actv  | 158 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル            | Mod<br>Actv | OLI0018 | 2-ペンタノン               | Mod<br>Actv  | 125 |

#### 実施例 6 . 感覚ニューロン調節因子阻害剤の同定

実施例 1 のプロトコルに従って、化合物および組み合わせを、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性を阻害する能力について試験した。ニューロンの阻害を分析するために、ベースライン活性レベルを下回ると記録された活性レベルを、ベースラインレベルに対する活性の低下の割合で表した。

#### 【 0 1 2 0 】

本アッセイで試験すると、いくつかの化合物は c p A ニューロン活性の低下をもたらした。ベースライン値と比較した活性の低下の割合に応じて、これらの化合物を、強力な阻害剤（60%を超える活性の低下）、中程度の阻害剤（40～60%の活性の低下）および穏やかな阻害剤（20～40%の活性の低下）に分類した。試験した単一の化合物およびその阻害レベルまたは分類のリストは表 10 に示される。

#### 【 0 1 2 1 】

10

20

30

40

【表 10】

表 10. 阻害剤化合物

| 化合物番号   | 化合物                         | 分類      |
|---------|-----------------------------|---------|
| OLI0067 | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン          | 強力な阻害剤  |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                | 強力な阻害剤  |
| OLI0069 | 2-エチル-3-メチルピラジン             | 強力な阻害剤  |
| OLI0070 | 2-メトキシ-3-メチルピラジン            | 強力な阻害剤  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン            | 中程度の阻害剤 |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピラジン | 中程度の阻害剤 |
| OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル                | 中程度の阻害剤 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                  | 中程度の阻害剤 |
| OLI0075 | オクタノン-3                     | 中程度の阻害剤 |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル                 | 中程度の阻害剤 |
| OLI0077 | トランス-2-デセナール                | 中程度の阻害剤 |
| OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート          | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0079 | チグリン酸 1-エチルヘキシル             | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0080 | 1-オクタノール                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0081 | 2,5-ジメチル-4-メトキシ-3(2H)フラノン   | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0082 | アルファ, アルファ-ジメチルフェネチルブチラート   | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0083 | 酪酸シス-3-ヘキセニル                | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール             | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0085 | ニコチン酸エチル                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0086 | ヘプタン酸エチル                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0087 | ユーカリプトール                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0088 | ペンテン酸フルフリル                  | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0089 | ゲラニルアセトン                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0090 | ゲラニルブチラート                   | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル                    | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0092 | メチルアミルケトン                   | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0093 | ローズマリー油                     | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0094 | ウイスキーラクトン                   | 穏やかな阻害剤 |
| OLI0095 | ベラトルアルデヒド                   | 穏やかな阻害剤 |

## 実施例 7 . 強力な阻害剤の組み合わせの同定

実施例 1 のプロトコルに従って、表 1 1 に記載される組み合わせを、CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性を阻害する能力について試験した。2 つまたは 3 つのいずれかの成分を含む組み合わせを、ニューロン活性を阻害する能力について試験した。表 1 1 に記載される組み合わせは、ベースライン活性と比較して 50 % を超えるニューロン活性の低下をもたらす 2 成分の組み合わせである。表 1 1 の組み合わせについて、各成分の濃度は 1 % であった。表中、「Act」は活性を指し、「Red」は低下を指し、「Compd」は化合物を指す。

【0122】

【表 1 1】

表 1 1. 2成分系阻害剤組成物

| Cmpd No. | 成分 A                   | Cmpd No. | 成分 B                             | Act (% Red) |
|----------|------------------------|----------|----------------------------------|-------------|
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0089  | ゲラニルアセトン                         | 64          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセター<br>ト           | 79          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0080  | 1-オクタノール                         | 81          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0082  | アルファ, アルファ-ジメチル<br>フェネチルブチラート    | 73          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0083  | 酪酸シス-3-ヘキセニル                     | 72          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0084  | シス-5-オクテン-1-オール                  | 77          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                       | 72          |
| OLI0102  | オイゲノール                 | OLI0095  | ベラトルアルデヒド                        | 68          |
| OLI0093  | ローズマリー油                | OLI0102  | オイゲノール                           | 74          |
| OLI0093  | ローズマリー油                | OLI0089  | ゲラニルアセトン                         | 61          |
| OLI0093  | ローズマリー油                | OLI0084  | シス-5-オクテン-1-オール                  | 64          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル       | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン                 | 63          |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル            | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6) イソ<br>プロピルピラジン | 56          |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル            | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                       | 57          |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル            | OLI0077  | トランス-2-デセナール                     | 58          |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル            | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン                 | 73          |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン       | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6) イソ<br>プロピルピラジン | 78          |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン       | OLI0073  | 酢酸シス-3-ヘキセニル                     | 73          |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン       | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                       | 79          |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン       | OLI0075  | オクタノン-3                          | 69          |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン       | OLI0077  | トランス-2-デセナール                     | 76          |
| OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン           | OLI0067  | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジ<br>ン           | 100         |
| OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン           | OLI0070  | 2-メトキシ-3-メチルピラジン                 | 100         |
| OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン           | OLI0069  | 2-エチル-3-メチルピラジン                  | 94          |
| OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン           | OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル                 | 87          |
| OLI0067  | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジ<br>ン | OLI0070  | 2-メトキシ-3-メチルピラジン                 | 100         |

10

20

30

40

表 1 2 に記載される組み合わせは 3 成分を含み、60%を超える CO<sub>2</sub> 応答性ニューロン活性の低下をもたらす。試験した 3 成分の組み合わせにおいて、各成分は 0.6% の濃度で試験溶液中に存在した。表中、「Act」は活性を指し、「Red」は低下を指し、「Comp」は成分を指し、「Cmpd」は化合物を指す。

【0123】

## 【表 1 2 - 1】

表 1 2. 3つの阻害剤の組み合わせ

| Cmpd    | Comp A                          | Cmpd    | Comp B                | Cmpd    | Comp C                          | Act<br>(%<br>Red) |
|---------|---------------------------------|---------|-----------------------|---------|---------------------------------|-------------------|
| OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニル<br>アセタート          | OLI0102 | オイゲノール                | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン           | 96                |
| OLI0080 | 1-オクタノール                        | OLI0102 | オイゲノール                | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン           | 100               |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                    | OLI0102 | オイゲノール                | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニル<br>アセタート          | 97                |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                    | OLI0102 | オイゲノール                | OLI0080 | 1-オクタノール                        | 97                |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                    | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | 100               |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン                    | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                      | 100               |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニル<br>アセタート          | 98                |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0080 | 1-オクタノール                        | 92                |
| OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0102 | オイゲノール                          | 98                |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                      | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | 93                |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                      | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン | OLI0102 | オイゲノール                          | 98                |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル            | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン          | OLI0080 | 1-オクタノール                        | 97                |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル            | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン          | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ<br>シピラジン           | 99                |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル            | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン          | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピル<br>ピラジン | 99                |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル            | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン          | OLI0102 | オイゲノール                          | 94                |

10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

|         |                      |         |                  |         |                        |     |
|---------|----------------------|---------|------------------|---------|------------------------|-----|
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラ<br>ジン | OLI0074 | ペンタン酸フルフ<br>リル         | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸<br>メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラ<br>ジン | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニ<br>ルアセタート | 96  |

## 実施例 8 . 相乗的な阻害剤の組み合わせの同定

興味深いことに、個々の成分が中程度の阻害（40～60%）または穏やかな阻害（20～40%）しか生じないか、あるいは c p B および c p C ニューロンを活性化することだけが知られている（ベータ活性化剤）場合に、いくつかの 2 成分および 3 成分の組み合わせは、60%を超える活性の低下をもたらす。予想外なことに、一実施形態では、中程度の活性化剤 2,3-ジメチルピラジンも、ベータ活性化剤（E）-ヘキサ-3-エン酸メチルと組み合わせると、60%を超える活性の低下をもたらした。

表 1 3 に記載される組み合わせは、組み合わせたときに相乗的に作用して、蚊のニューロン活性を阻害することが初めて示された。研究において、2 成分の組み合わせは成分 A および成分 B のそれぞれ 1% の試験溶液を包含し、3 成分の組み合わせは成分 A、B および C のそれぞれ 0.6% の試験溶液を包含した。表中の「x」は、成分が存在しないことを示す。表中、「Act」は活性を指し、「Compd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指し、「Red」は低下を指し、「Mod」は中程度を指し、「Inh」は阻害剤を指し、「Actv」は活性化剤を指す。

【0125】

10

20

【表 13 - 1】

表 13. 相乗効果を有する阻害剤組成物

| Cmpd No. | Comp A  | 分類 A     | Cmpd No. | Comp B                    | 分類 B     | Cmpd No. | Comp C | 分類 C | Act (% Red) |
|----------|---------|----------|----------|---------------------------|----------|----------|--------|------|-------------|
| OLI0093  | ローズマリー油 | 穏やかな Inh | OLI0089  | ゲラニルアセトン                  | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 61          |
| OLI0093  | ローズマリー油 | 穏やかな Inh | OLI0084  | シス-5-オクテン-1-オール           | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 64          |
| OLI0093  | ローズマリー油 | 穏やかな Inh | OLI0102  | オイゲノール                    | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 74          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0089  | ゲラニルアセトン                  | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 64          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート        | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 79          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0082  | アルファ, アルファ-ジメチルフェネチルブチラート | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 73          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0083  | 酪酸シス-3-ヘキセニル              | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 72          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0084  | シス-5-オクテン-1-オール           | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 77          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                | Mod Inh  |          | x      | x    | 72          |
| OLI0102  | オイゲノール  | 穏やかな Inh | OLI0095  | ベラトルアルデヒド                 | 穏やかな Inh |          | x      | x    | 68          |

10

20

30

【 0 1 2 6 】

【表 13 - 2】

|         |                  |          |         |                           |          |         |                    |          |     |
|---------|------------------|----------|---------|---------------------------|----------|---------|--------------------|----------|-----|
| OLI0102 | オイゲノール           | 穏やかな Inh | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート        | 穏やかな Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | Mod Inh  | 96  |
| OLI0102 | オイゲノール           | 穏やかな Inh | OLI0080 | 1-オクタノール                  | 穏やかな Inh |         | x                  | x        | 81  |
| OLI0102 | オイゲノール           | 穏やかな Inh | OLI0080 | 1-オクタノール                  | 穏やかな Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | Mod Inh  | 100 |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル      | Mod Inh  | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン          | Mod Inh  |         | x                  | x        | 73  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh  |         | x                  | x        | 78  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh  | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 穏やかな Inh | 98  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh  | OLI0080 | 1-オクタノール           | 穏やかな Inh | 92  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh  | OLI0102 | オイゲノール             | 穏やかな Inh | 98  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル          | ベータ Actv |         | X                  | x        | 63  |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh  | OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル              | Mod Inh  |         | X                  | x        | 73  |

10

20

30

40

【表 1 3 - 3】

|         |                           |             |         |                           |             |         |   |              |    |
|---------|---------------------------|-------------|---------|---------------------------|-------------|---------|---|--------------|----|
| OLI0071 | 2-エチル<br>-3-メトキシ<br>シピラジン | Mod<br>Inh  | OLI0074 | ペンタン酸<br>フルフリル            | Mod<br>Inh  |         | X   | x            | 79 |
| OLI0071 | 2-エチル<br>-3-メトキシ<br>シピラジン | Mod<br>Inh  | OLI0075 | オクタノン<br>-3               | Mod<br>Inh  |         | X   | x            | 69 |
| OLI0071 | 2-エチル<br>-3-メトキシ<br>シピラジン | Mod<br>Inh  | OLI0077 | トランス<br>-2-デセナ<br>ール      | Mod<br>Inh  |         | X   | x            | 76 |
| OLI0074 | ペンタン酸<br>フルフリル            | Mod<br>Inh  | OLI0071 | 2-エチル<br>-3-メトキシ<br>シピラジン | Mod<br>Inh  | OLI0072 | 2-メトキシ<br>-3(5ま<br>たは6)イ<br>ソプロピ<br>ルピラジ<br>ン | Mod<br>Inh   | 93 |
| OLI0074 | ペンタン酸<br>フルフリル            | Mod<br>Inh  | OLI0071 | 2-エチル<br>-3-メトキシ<br>シピラジン | Mod<br>Inh  | OLI0102 | オイゲノ<br>ール                                    | 穏やか<br>な Inh | 98 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ<br>-3-エン酸<br>メチル  | ベータ<br>Actv | OLI0015 | 2,3-ジメチ<br>ルピラジン          | Mod<br>Actv |         | X   | x            | 87 |

## 実施例 9 . 環境的に安全な化合物の同定

有害生物および刺咬性昆虫を防除するために、有害な化学物質が使用されることが多い。いくつかの化学物質によって市民の健康および環境に引き起こされる危険に対する市民意識の高まりと共に、合成または危険な化学物質の代替手段としてますます天然化合物が探索されている。この目的のために、環境保護庁 (Environmental Protection Agency) は、特定の天然化合物を安全であると分類し、これらの環境的に安全な化合物の使用を特定の政府規制から保護するための法的措置を取っている。連邦殺虫剤、殺菌剤および殺鼠剤法 (FIFRA) は、適用外およびこの法律によって包含される化合物の概略を述べている。これらの化合物としては、オイゲノール (OLI0102)、ローズマリー油 (OLI0093)、ペパーミント油 (OLI0101) およびプロピオン酸フェネチル (OLI0076) がある。

## 【0128】

本アッセイにおいて、オイゲノール、ローズマリー油、ペパーミント油およびプロピオン酸フェネチルを、ニューロン活性に対する効果について試験した。ローズマリー油およびオイゲノールは穏やかな阻害剤であることが見出され、プロピオン酸フェネチルは中程度の阻害剤であることが見出され、ペパーミント油はベータ活性化剤であることが見出された。

## 【0129】

実施例 1 に記載された方法に従って、2つまたは3つのいずれかの成分を有する表 1 4 に記載される組成物において、環境的に安全な化合物を含有する組み合わせを阻害活性について試験した。2成分を有する試験溶液はそれぞれ 1% の記載される成分で構成し、3成分を有する試験溶液は、それぞれ 0.6% の記載される成分で構成した。各組み合わせ

中の成分 A は環境的に安全な化合物である。表注の「x」は、成分が存在しないことを示す。表中、「Act」は活性を指し、「Cmpd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指し、「Red」は低下を指す。

【 0 1 3 0 】

【表 1 4 - 1】

表 1 4 . 少なくとも 1 つの環境的に安全な化合物を含有する阻害性の組み合わせ

| Cmpd No. | Comp A | Cmpd No. | Comp B             | Cmpd No. | Comp C             | Act (% Red) |
|----------|--------|----------|--------------------|----------|--------------------|-------------|
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 96          |
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート |          | X                  | 79          |
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0080  | 1-オクタノール           | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 100         |
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0080  | 1-オクタノール           |          | X                  | 81          |
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル   | 94          |
| OLI0102  | オイゲノール | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 97          |

10

20

【 0 1 3 1 】

【表 1 4 - 2】

|         |                 |         |                                      |         |                                   |    |
|---------|-----------------|---------|--------------------------------------|---------|-----------------------------------|----|
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0068 | 2,3-ジエチルピ<br>ラジン                     | OLI0080 | 1-オクタノール                          | 97 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0071 | 2-エチル-3-メト<br>キシピラジン                 | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5<br>または6)イソプ<br>ロピルピラジン | 98 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0071 | 2-エチル-3-メト<br>キシピラジン                 | OLI0074 | ペンタン酸フル<br>フリル                    | 98 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0082 | アルファ,アルフ<br>ァ-ジメチルフェ<br>ネチルブチラー<br>ト |         | X                                 | 73 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0083 | 酪酸シス-3-ヘキ<br>セニル                     |         | X                                 | 72 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0084 | シス-5-オクテン<br>-<br>1-オール              |         | X                                 | 77 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0074 | ペンタン酸フル<br>フリル                       |         | X                                 | 72 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0089 | ゲラニルアセト<br>ン                         |         | X                                 | 64 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0093 | ローズマリー油                              |         | X                                 | 74 |
| OLI0102 | オイゲノール          | OLI0095 | ベラトルアルデ<br>ヒド                        |         | X                                 | 68 |
| OLI0076 | プロピオン酸<br>フェネチル | OLI0071 | 2-エチル-3-メト<br>キシピラジン                 |         | X                                 | 73 |
| OLI0076 | プロピオン酸<br>フェネチル | OLI0074 | ペンタン酸フル<br>フリル                       |         | X                                 | 57 |
| OLI0076 | プロピオン酸<br>フェネチル | OLI0077 | トランス-2-<br>デセナール                     |         | X                                 | 58 |
| OLI0076 | プロピオン酸<br>フェネチル | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5<br>または6)イソプ<br>ロピルピラジン    |         | X                                 | 56 |
| OLI0093 | ローズマリー<br>油     | OLI0084 | シス-5-オクテン<br>-<br>1-オール              |         | X                                 | 64 |
| OLI0093 | ローズマリー<br>油     | OLI0089 | ゲラニルアセト<br>ン                         |         | X                                 | 61 |

## 実施例 10 . ベータ活性化剤を含む活性化剤の組み合わせの同定

二酸化炭素受容体ニューロンは、蚊小顎鬚の錐状感覚器 (basiconic sensilla) 内に収容されている。cpAニューロンからの活性は最大振幅のスパイクを生じるが、この領域に存在するcpBおよびcpCニューロンは、皮膚の臭気に対しても応答性である。これらのニューロンからの活性も、実施例1に記載された電気生理学的方法によって検出することができる。

10

20

30

40

50

## 【0132】

c p Bおよびc p Cニューロンからの活性を互いに容易に区別することはできないが、これらの集合的な活性は、c p Aニューロンによって生じるスパイクよりもはるかに低い振幅を有するスパイクを生じるため、c p Aニューロンとは区別することができる。

## 【0133】

本研究では、ベータ活性化剤として同定される化合物は、(E)-ヘキサ-3-エン酸メチル、ペンタン酸フルフリル、シス-5-オクテン-1-オール、チグリン酸1-エチルヘキシル、ペパーミント油、ギ酸イソアミル、ギ酸シス-3-ヘキセニル、ギ酸ヘキシル、レブリン酸メチルおよびプロピオン酸イソアミルを含む。

## 【0134】

興味深いことに、ペンタン酸フルフリルは、中程度のc p A阻害剤でもあり、シス-5-オクテン-1-オールおよびチグリン酸1-エチルヘキシルは穏やかなc p A阻害剤でもある。レブリン酸メチルは中程度のc p A活性化剤でもある。

10

## 【0135】

実施例1において既に記載したアッセイを用いて、ベータ活性化剤成分を含有する組み合わせを、c p Aニューロン活性に対する効果について試験した。種々の組み合わせは、組み合わせに含まれる付加的な成分に応じて、活性の増大または活性の低下のいずれかの能力を有することが決定された。少なくとも1つのベータ活性化剤成分を含有する組み合わせは、c p Aニューロン活性の増大をもたらした。データは表15に示される。それぞれの組み合わせについて、2つの成分のそれぞれの濃度は1%であった。驚くべきことに、これらの成分を特定の中程度の活性化剤と組み合わせると、得られる組み合わせは、強力または非常に強力な活性化剤の役割を果たした。表中、「Act」は活性を指し、「Compd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指し、「Mod」は中程度を指し、「Actv」は活性化剤を指す。

20

## 【0136】

【表 15 - 1】

表 15. ベータ活性化剤を含む活性化剤の組み合わせ

| Cmpd No. | Comp A           | 分類 A     | Cmpd No. | Comp B            | 分類 B     | Act (spk/秒) |
|----------|------------------|----------|----------|-------------------|----------|-------------|
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod Actv | 77          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン   | Mod Actv | 77          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod Actv | 82          |
| OLI0098  | ギ酸イソアミル          | ベータ Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod Actv | 63          |
| OLI0098  | ギ酸イソアミル          | ベータ Actv | OLI0022  | アセト酢酸エチル          | Mod Actv | 63          |
| OLI0099  | プロピオン酸イソアミル      | ベータ Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod Actv | 69          |
| OLI0098  | ギ酸イソアミル          | ベータ Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod Actv | 69          |
| OLI0096  | ギ酸シス-3-ヘキセニル     | ベータ Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod Actv | 72          |
| OLI0097  | ギ酸ヘキシル           | ベータ Actv | OLI0014  | 2, 3, 5-トリメチルピラジン | Mod Actv | 75          |
| OLI0097  | ギ酸ヘキシル           | ベータ Actv | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン       | Mod Actv | 82          |
| OLI0098  | ギ酸イソアミル          | ベータ Actv | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod Actv | 83          |
| OLI0097  | ギ酸ヘキシル           | ベータ Actv | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod Actv | 115         |
| OLI0099  | プロピオン酸イソアミル      | ベータ Actv | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod Actv | 118         |
| OLI0096  | ギ酸シス-3-ヘキセニル     | ベータ Actv | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン       | Mod Actv | 147         |
| OLI0027  | レブリン酸メチル         | ベータ Actv | OLI0020  | シンナミルニトリル         | Mod Actv | 70          |
| OLI0027  | レブリン酸メチル         | ベータ Actv | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド     | Mod Actv | 96          |
| OLI0027  | レブリン酸メチル         | ベータ Actv | OLI0015  | 2, 3-ジメチルピラジン     | Mod Actv | 97          |
| OLI0027  | レブリン酸メチル         | ベータ Actv | OLI0026  | クロトン酸メチル          | Mod Actv | 92          |

10

20

30

40

【 0 1 3 7 】

【表 15 - 2】

|         |          |             |         |                     |             |     |
|---------|----------|-------------|---------|---------------------|-------------|-----|
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0019 | 酪酸アリル               | Mod<br>Actv | 78  |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0014 | 2,3,5-トリメチルピ<br>ラジン | Mod<br>Actv | 107 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0022 | アセト酢酸エチル            | Mod<br>Actv | 144 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0025 | メタンチオールアセ<br>タート    | Mod<br>Actv | 160 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサ<br>ン酸エチル | Mod<br>Actv | 126 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラク<br>ト      | Mod<br>Actv | 158 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル | ベータ<br>Actv | OLI0018 | 2-ペンタノン             | Mod<br>Actv | 125 |

10

## 実施例 11 . ベータ活性化剤を含む阻害剤の組み合わせの同定

ベータ活性化剤のさらなる調査によって、c p A ニューロン活性の低下をもたらす少なくとも1つのベータ活性化剤成分を含有する組み合わせが明らかになった。これらのデータは表 16 に示される。2つの成分が組み合わせられる場合、それぞれの濃度は1%である。3つの成分が試験される場合、それぞれの濃度は0.6%であった。

20

## 【0138】

1つの試験では、組み合わせは、ベータ活性化剤(E) - ヘキサ - 3 - エン酸メチルと、中程度の活性化剤 2, 3 - ジメチルピラジンとを包含した。予想外なことに、この組成物はニューロン活性の強力な阻害剤の役割を果たす。

## 【0139】

ペンタン酸フルフリルは食品における一般的な風味剤である。ペンタン酸フルフリルは単独でベータ活性化剤およびc p A ニューロン活性の中程度の阻害剤の役割を果たすことができるが、ペンタン酸フルフリルを含有する種々の組み合わせを用いて実行されたアッセイにより、c p A ニューロン活性の強力な阻害をもたらす相乗効果が明らかにされた。

30

## 【0140】

1つの例において、ペンタン酸フルフリルと、穏やかな阻害剤オイゲノールとを含む組み合わせは、試験したときに強力な阻害をもたらした。

別の例において、ペンタン酸フルフリルと、2 - エチル - 3 - メトキシピラジン (中程度の阻害剤) とを含む組み合わせは、試験したときに強力な阻害をもたらした。

## 【0141】

別の例において、ペンタン酸フルフリルと、2 - エチル - 3 - メトキシピラジンと、2 - メトキシ - 3 (5 または 6) イソプロピルピラジン (中程度の阻害剤) とを含む組み合わせは、試験したときに強力な阻害をもたらした。

40

## 【0142】

さらに別の例において、ペンタン酸フルフリルと、2 - エチル - 3 - メトキシピラジンと、オイゲノールとを含む組み合わせは、試験したときに強力な阻害をもたらした。

別の一般的な風味剤のシス - 5 - オクテン - 1 - オールは、一般に、食品にメロンフレーバーを付与するために使用される。この化合物は、ベータ活性化剤およびc p A ニューロン活性の穏やかな阻害剤の両方の役割を果たすことができる。驚くべきことに、シス - 5 - オクテン - 1 - オールおよびオイゲノールを含む組み合わせは、試験したときにc p A ニューロン活性の強力な阻害をもたらした。表中、「Act」は活性を指し、「Compd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指し、「Red」は低下を指し、「Mod」

50

は中程度を指し、「Strng」は強力を指し、「Inh」は阻害剤を指し、「Actv」は活性化剤を指す。

【0143】

【表16-1】

表16. ベータ活性化剤を含有する阻害剤の組み合わせ

| Cmpd No. | Comp A           | 分類 A     | Cmpd No. | Comp B       | 分類 B      | Cmpd No. | Comp C                    | 分類 C     | Act (% Red) |
|----------|------------------|----------|----------|--------------|-----------|----------|---------------------------|----------|-------------|
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン | Mod Actv  |          | X                         |          | 87          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン | Strng Inh | OLI0080  | 1-オクタノール                  | 穏やかな Inh | 97          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン | Strng Inh | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン          | Mod Inh  | 99          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン | Strng Inh | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh  | 99          |
| OLI0100  | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv | OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン | Strng Inh | OLI0102  | オイゲノール                    | 穏やかな Inh | 94          |

10

20

30

【0144】

【表 16 - 2】

|         |                  |                      |         |                   |           |         |                           |                      |     |
|---------|------------------|----------------------|---------|-------------------|-----------|---------|---------------------------|----------------------|-----|
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv             | OLI0068 | 2,3-ジエチル-ピラジン     | Strng Inh | OLI0088 | ペンタン酸フルフリル                | ベータ Actv および Mod Inh | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv             | OLI0068 | 2,3-ジエチル-ピラジン     | Strng Inh | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート        | 穏やかな Inh             | 96  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0102 | オイゲノール            | 穏やかな Inh  |         | X                         |                      | 72  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0076 | プロピオン酸フェネチル       | Mod Inh   |         | X                         |                      | 57  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ-ピラジン | Mod Inh   |         | X                         |                      | 79  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ-ピラジン | Mod Inh   | OLI0068 | 2,3-ジエチル-ピラジン             | Strng Inh            | 100 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ-ピラジン | Mod Inh   | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh              | 93  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシ-ピラジン | Mod Inh   | OLI0102 | オイゲノール                    | 穏やかな Inh             | 98  |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール  | ベータ Actv および穏やかな Inh | OLI0102 | オイゲノール            | 穏やかな Inh  |         | X                         |                      | 77  |

10

20

30

40

## 実施例 12 . エリア行動アッセイ

本発明の化合物および組成物の評価に役立つための行動アッセイを開発した。これらのアッセイには、着地アッセイおよびネットスフェアアッセイが含まれる。これらのアッセイを用いて、アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) 種の蚊の誘引または忌避に関する前記化合物および組成物の有効性を決定した。双翅 (*Diptera*) 目の全体にわたる二酸化炭素受容体の高度な保存性のために、アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) に対して得られる結果は、蚊科 (クリキダエ (*Culicidae*))

50

d a e ) ) の他のメンバーに関して、および他の双翅類のメンバーに関して、直観的な知識である可能性が高い。

【 0 1 4 5 】

着地アッセイ

着地アッセイは、ヒトの皮膚への誘引について試験するために使用されるアッセイである。切り取られた開口を2層メッシュで保護した手袋をはめたヒトの手を、メス蚊の約  $30 \times 30 \times 30$  cm (  $12 \times 12 \times 12$  インチ ) のケージに挿入した。メッシュの第1の層は、化学物質の接触および蚊の接触からヒトを保護するために使用した。メッシュの第2の層を1%の濃度でアセトン中に溶解した化合物または組成物で処理し、前記メッシュ上で3分間乾燥させた。このメッシュの第2の層を第1のメッシュ層の上に配置した。2つのメッシュ層は、手袋の適所に層を保持するための外側磁性ストリップにより隔てた。この実験設計は、被験体の飢餓メス蚊が、ヒト皮膚の臭気および化合物または組成物に同時に曝露されることを可能にする。ケージは30匹のメスおよび3匹のオスの蚊を含有した。5分間の時間経過にわたって処理表面への蚊の着地をビデオテープに録画し、その時間の間の着地回数を記録した。アセトンのみで処理したメッシュを陰性対照として使用した。この実験は、試験した各化合物または組成物につき3回行った。1つのこのような実験からの結果は図2に示される。

10

【 0 1 4 6 】

データから、化合物シクロペンタノンおよび2-ペンタノンはブランク対照(30回の着地)よりも多数の着地(それぞれ39回および37回)をもたらしたことが明らかである。さらに、化合物2-エチルピラジンは、同じ時間枠で12回の着地をもたらし、忌避剤とされる。興味深いことに、この化合物は、 $CO_2$  応答性ニューロンの活性化剤であることが示されている。この例では、この化合物はマスキング剤の機能を果たし、恐らくその $CO_2$  受容体を圧倒することによって、蚊の宿主探索(host-seeking)応答を妨害する。

20

【 0 1 4 7 】

実施例13. ネットスフェアアッセイ

セミフィールド閉じ込め区域においてネットスフェアアッセイを実行した。閉じ込め区域は約93平方メートル(1,000平方フィート)のサイズであり、アエデス・アegypti ( *Aedes aegypti* ) 蚊が野生で遭遇し得る条件を再現するように、温度、湿度、照明および空気流などの環境要因を制御した。実験の前に閉じ込め区域を2時間調整して、環境条件を均質にした。次に50匹のメスおよび5匹のオスの蚊をチャンバ内に放出し、環境に順応させるために1時間おいた。その後、BG-センチネル(BG-Sentinel)トラップ(バイオジェンツ(Biogents)AG、独国レーゲンスブルク)にシクロペンタノン、2-ペンタノンまたは2,4-ルチジンのいずれかを仕掛け、仕掛けのないBG-センチネル(トラップ誘引の陰性対照として)の存在下、チャンバ内に配置した。採取を一晚続行させ、その間、チャンバ内の照明条件は、星の光を模倣するように設定した。翌日、トラップに捕獲された蚊を-20で凍結して、カウントした。これらのカウントを、250ml/分の流速のタンクからの $CO_2$  が誘惑物として使用される対照実験と比較した。1つのこのような実験の結果は図3に示される。

30

40

【 0 1 4 8 】

データから、化合物シクロペンタノンおよび2-ペンタノンは、 $CO_2$  のみの場合と同様に、誘引剤の役割を果たすことが明らかである。さらに、化合物2,4-ルチジンは忌避剤の役割を果たした。興味深いことに、この化合物は、 $CO_2$  応答性ニューロンの強力な活性化剤であることが示されており、使用濃度において、この化合物によるこれらのニューロンの活性化は蚊による化合物の回避をもたらすことが示唆される。

【 0 1 4 9 】

実施例14. 殺幼虫活性アッセイ

6ウェルプレート(コーニング・ライフ・サイエンス(Corning Life Sciences)、マサチューセッツ州テュークスベリー)を使用して化合物の殺幼虫活

50

性を試験する。約20匹の幼虫を以下の条件下で各ウェルに添加した：陰性対照（幼虫を5 mLの蒸留水と組み合わせる）；陽性対照（幼虫を4.5 mLの蒸留水および0.5 mLのエタノールと組み合わせる）；処理1 [ 幼虫を、100 ppm（百万分の一）の化合物Aを含む溶液5 mLと組み合わせる ] ；処理2（幼虫を、0.25%の化合物Aを含む溶液5 mLと組み合わせる）；処理3（幼虫を、100 ppmの化合物Bを含む溶液5 mLと組み合わせる）；処理4（幼虫を、0.25%の化合物Bを含む溶液5 mLと組み合わせる）。24時間の曝露の後、死んだ幼虫の数をカウントし、記録する。

【0150】

実施例15．殺生物活性アッセイ

部屋を26 および60～70%の相対湿度に調整した。使用するボトル、蓋およびメッシュカバーを普通の食器用セッケンで洗浄する。ボトルおよび蓋を完全に乾燥させる。10 一片の番号1のワットマン（Whatman）ろ紙を各ボトルの底に入れる。鉗子を用いて、ボトルの底に対して適切にろ紙を配置する。ろ紙に適用される希釈濃度により各ボトルにラベルを付ける。20 mg/mLの希釈から始めて、試験管において段階希釈物を調製した。試験管に適切な希釈濃度のラベルを付ける。

【0151】

1000 μlのアセトン中20 mg/mLの希釈から始めて、エペンドルフチューブにおいて試験化合物を段階希釈し、連続する各チューブにおいて10倍ずつの希釈物を作成する。500 μlの各溶液（アセトンのみを対照を含む）を対応するボトル内のろ紙に適用し、乾燥させる。飢餓状態でない20匹のメス蚊を各ボトルに移し、上部をメッシュ 20 で封止する。次に、調整した実験室内にボトルを2時間置く。次に蚊を観察し、各ボトル内の動きのない蚊の数を記録する。

【0152】

実施例16．本発明の化合物の殺幼虫効果および殺生物効果

実施例14および15に記載された方法に従って、本発明の化合物を分析した。殺幼虫活性は、本発明の化合物について、100 ppm（百万分の一）および0.25%の用量で、実施例14に従って評価した。結果は、致死率%（死んだ幼虫の数を幼虫の総数で除したもの）として表17に示される。

【0153】

【表 17 - 1】

表 17. 殺幼虫活性

| 化合物<br>番号 | 化合物                             | 100 ppm にお<br>ける致死率% | 0.25%の化合物濃<br>度による致死率% |
|-----------|---------------------------------|----------------------|------------------------|
| OLI0116   | サリチルアルデヒド                       | 100% 致死              | 100% 致死                |
| OLI0005   | 4-エチルフェノール                      | 100% 致死              | 100% 致死                |
| OLI0020   | シンナミルニトリル                       | 100% 致死              | 100% 致死                |
| OLI0052   | インドール                           | 100% 致死              | 100% 致死                |
| OLI0101   | ペパーミント油                         | 88% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0059   | メチルヘプタジエノン                      | 58% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0075   | オクタノン-3                         | 50% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0017   | 2-フリルメチルケトン                     | 50% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0111   | メンタラクトン                         | 33% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0102   | オイゲノール                          | 25% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0028   | フェニルアセトアルデヒド                    | 25% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0104   | ケイ皮酸アリル                         | 15% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0077   | トランス-2-デセナール                    | 10% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0106   | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール              | 10% 致死               | 100% 致死                |
| OLI0001   | 2,4-ルチジン                        | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0003   | 2-メトキシピラジン                      | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0006   | 5-メチルフルフラール                     | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0009   | 2-フロ酸エチル                        | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0012   | グアヤコール                          | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0016   | 2-アセチル-5-メチルフラン                 | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0019   | 酪酸アリル                           | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0024   | ガンマ-ヘプタラクトン                     | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0025   | メタンチオールアセタート                    | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0029   | フェニルプロピルアルデヒド                   | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0065   | トランス-シンナムアルデヒド                  | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0067   | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン              | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0068   | 2,3-ジエチルピラジン                    | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0069   | 2-エチル-3-メチルピラジン                 | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0070   | 2-メトキシ-3-メチルピラジン                | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0071   | 2-エチル-3-メトキシピラジン                | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0072   | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピ<br>ラジン | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0074   | ペンタン酸フルフリル                      | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0076   | プロピオン酸フェネチル                     | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0079   | チグリン酸 1-エチルヘキシル                 | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0084   | シス-5-オクテン-1-オール                 | 0% 致死                | 100% 致死                |
| OLI0100   | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル                | 0% 致死                | 100% 致死                |

10

20

30

40

【表 17 - 2】

|         |                          |        |          |
|---------|--------------------------|--------|----------|
| OLI0105 | プロピオン酸トランス-シンナミル         | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0107 | ギ酸シンナミル                  | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0109 | プロピオン酸シンナミル              | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0110 | ケイ皮酸エチル                  | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0112 | メトキシケイ皮酸アルデヒド            | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0113 | ケイ皮酸メチル                  | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0114 | トランス-ケイ皮酸メチル             | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0115 | メントール                    | 0 % 致死 | 100% 致死  |
| OLI0117 | イソ酪酸シンナミル                | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0118 | ウルトラズール(Ultrazur (登録商標)) | 0% 致死  | 100% 致死  |
| OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル             | 0% 致死  | 95% 致死   |
| OLI0026 | クロトン酸メチル                 | 0% 致死  | 87.5% 致死 |
| OLI0008 | シクロペンタノン                 | 0% 致死  | 85% 致死   |
| OLI0092 | メチルアミルケトン                | 32% 致死 | 73% 致死   |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブテナール       | 0% 致死  | 72% 致死   |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル                 | 0% 致死  | 72% 致死   |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン                | 0% 致死  | 50% 致死   |
| OLI0027 | レブリン酸メチル                 | 0% 致死  | 50% 致死   |
| OLI0066 | バレラルデヒド                  | 0 % 致死 | 35% 致死   |
| OLI0096 | ギ酸シス 3-ヘキセニル             | 0% 致死  | 30% 致死   |
| OLI0011 | エチルビニルカルビノール             | 5% 致死  | 27% 致死   |
| OLI0014 | 2,3,5-トリメチルピラジン          | 0% 致死  | 21% 致死   |
| OLI0119 | 酪酸ヘキシル                   | 0% 致死  | 15% 致死   |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル                   | 0% 致死  | 5% 致死    |
| OLI0018 | 2-ペンタノン                  | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0063 | ギ酸プロピル                   | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0015 | 2,3-ジメチルピラジン             | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0004 | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン      | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0010 | 乳酸エチル                    | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル          | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0103 | ケイ皮酸フェネチル                | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0120 | ケイ皮酸ベンジル                 | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0007 | ギ酸ブチル                    | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0042 | 3-ヒドロキシ酪酸エチル             | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル                 | 0% 致死  | 0% 致死    |
| OLI0099 | プロピオン酸イソアミル              | 0% 致死  | 0% 致死    |

10

20

30

40

実施例 15 の方法に従って本発明の化合物の殺生物活性を評価した。化合物は、0.2 mg/ml および 2 mg/ml で試験した。結果は、死亡率% (死んだ蚊の数を蚊の総数で除したもの) として表 18 に示される。

【0155】

【表 18 - 1】

表 18. 殺生物活性

| 化合物<br>番号 | 化合物                          | 0.2 mg/ml<br>による<br>死亡率% | 2 mg/ml<br>による<br>死亡率% |
|-----------|------------------------------|--------------------------|------------------------|
| OLI0108   | イソ酪酸シンナミル                    | 10                       | 100                    |
| OLI0005   | 4-エチルフェノール                   | 0                        | 100                    |
| OLI0020   | シンナミルニトリル                    | 0                        | 100                    |
| OLI0052   | インドール                        | 0                        | 100                    |
| OLI0076   | プロピオン酸フェネチル                  | 0                        | 100                    |
| OLI0077   | トランス-2-デセナール                 | 0                        | 100                    |
| OLI0102   | オイゲノール                       | 0                        | 100                    |
| OLI0106   | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール           | 0                        | 100                    |
| OLI0107   | ギ酸シンナミル                      | 0                        | 100                    |
| OLI0109   | プロピオン酸シンナミル                  | 0                        | 100                    |
| OLI0110   | ケイ皮酸エチル                      | 0                        | 100                    |
| OLI0111   | メンタラクトン                      | 0                        | 100                    |
| OLI0112   | メトキシケイ皮酸アルデヒド                | 0                        | 100                    |
| OLI0113   | ケイ皮酸メチル                      | 0                        | 100                    |
| OLI0114   | トランス-ケイ皮酸メチル                 | 0                        | 100                    |
| OLI0084   | シス-5-オクテン-1-オール              | 0                        | 95                     |
| OLI0105   | プロピオン酸トランス-シンナミル             | 0                        | 85                     |
| OLI0021   | 3-ヒドロキシヘキサ酸エチル               | 0                        | 75                     |
| OLI0104   | ケイ皮酸アリル                      | 0                        | 45                     |
| OLI0103   | ケイ皮酸フェネチル                    | 5                        | 25                     |
| OLI0029   | フェニルプロピルアルデヒド                | 0                        | 15                     |
| OLI0079   | チグリン酸 1-エチルヘキシル              | 0                        | 15                     |
| OLI0014   | 2, 3, 5-トリメチルピラジン            | 0                        | 0                      |
| OLI0067   | 2, 3-ジエチル-5-メチルピラジン          | 0                        | 0                      |
| OLI0068   | 2, 3-ジエチルピラジン                | 0                        | 0                      |
| OLI0015   | 2, 3-ジメチルピラジン                | 0                        | 0                      |
| OLI0001   | 2, 4-ルチジン                    | 0                        | 0                      |
| OLI0016   | 2-アセチル-5-メチルフラン              | 0                        | 0                      |
| OLI0071   | 2-エチル-3-メトキシピラジン             | 0                        | 0                      |
| OLI0002   | 2-エチルピラジン                    | 0                        | 0                      |
| OLI0017   | 2-フリルメチルケトン                  | 0                        | 0                      |
| OLI0032   | 2-メトキシ-3(5 または 6) イソプロピルピラジン | 0                        | 0                      |
| OLI0070   | 2-メトキシ-3-メチルピラジン             | 0                        | 0                      |
| OLI0003   | 2-メトキシピラジン                   | 0                        | 0                      |
| OLI0004   | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン          | 0                        | 0                      |
| OLI0018   | 2-ペンタノン                      | 0                        | 0                      |

【表 18 - 2】

|         |                          |   |   |
|---------|--------------------------|---|---|
| OLI0069 | 2-エチル-3-メチルピラジン          | 0 | 0 |
| OLI0006 | 5-メチルフルフラール              | 0 | 0 |
| OLI0019 | 酪酸アリル                    | 0 | 0 |
| OLI0120 | ケイ皮酸ベンジル                 | 0 | 0 |
| OLI0007 | ギ酸ブチル                    | 0 | 0 |
| OLI0096 | ギ酸シス 3-ヘキセニル             | 0 | 0 |
| OLI0073 | 酢酸シス-3-ヘキセニル             | 0 | 0 |
| OLI0008 | シクロペンタノン                 | 0 | 0 |
| OLI0009 | 2-フロ酸エチル                 | 0 | 0 |
| OLI0042 | 3-ヒドロキシ酪酸エチル             | 0 | 0 |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル                 | 0 | 0 |
| OLI0010 | 乳酸エチル                    | 0 | 0 |
| OLI0011 | エチルビニルカルビノール             | 0 | 0 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル               | 0 | 0 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン              | 0 | 0 |
| OLI0012 | グアヤコール                   | 0 | 0 |
| OLI0119 | 酪酸ヘキシル                   | 0 | 0 |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル                   | 0 | 0 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         | 0 | 0 |
| OLI0099 | プロピオン酸イソアミル              | 0 | 0 |
| OLI0115 | メントール                    | 0 | 0 |
| OLI0025 | メタンチオールアセタート             | 0 | 0 |
| OLI0092 | メチルアミルケトン                | 0 | 0 |
| OLI0026 | クロトン酸メチル                 | 0 | 0 |
| OLI0059 | メチルヘプタジエノン               | 0 | 0 |
| OLI0091 | ヘプタン酸メチル                 | 0 | 0 |
| OLI0027 | レブリン酸メチル                 | 0 | 0 |
| OLI0075 | オクタノン-3                  | 0 | 0 |
| OLI0101 | ペパーミント油                  | 0 | 0 |
| OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド             | 0 | 0 |
| OLI0063 | ギ酸プロピル                   | 0 | 0 |
| OLI0116 | サリチルアルデヒド                | 0 | 0 |
| OLI0013 | トランス-2-メチル-2-ブテナール       | 0 | 0 |
| OLI0065 | トランス-シンナムアルデヒド           | 0 | 0 |
| OLI0118 | ウルトラズール(Ultrazur (登録商標)) | 0 | 0 |
| OLI0066 | バレルアルデヒド                 | 0 | 0 |

実施例 15 の方法に従って本発明の化合物を含む組み合わせの殺生物活性を評価した。組み合わせは、0.2 mg/ml および 2 mg/ml (組み合わせた化合物の総濃度) で試験した。結果は、死亡率% (死んだ蚊の数を蚊の総数で除したもの) として表 19 に示される。表中、「Mort」は死亡率を指し、「Compd」は化合物を指し、「Comp」は成分を指す。

【0157】

10

20

30

40

50

## 【表 19 - 1】

表 19. 組み合わせの殺生物活性

| Cmpd No. | Comp A           | Cmpd No. | Comp B                      | Cmpd No. | Comp C | 0.2 mg/ml による Mort% | 2.0 mg/ml による Mort% |
|----------|------------------|----------|-----------------------------|----------|--------|---------------------|---------------------|
| OLI0092  | メチルアミルケトン        | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン                 |          | x      | 0                   | 5                   |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0088  | ペンタン酸フルフリル                  |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン            |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピラジン |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0077  | トランス-2-デセナール                |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0088  | ペンタン酸フルフリル                  |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0077  | トランス-2-デセナール                |          | x      | 65                  | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピラジン |          | x      | 0                   | 45                  |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン                 |          | x      | 0                   | 95                  |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド               |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン                |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン             |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン                 |          | x      | 0                   | 100                 |

10

20

30

40

【 0 1 5 8 】

【表 19 - 2】

|         |                         |         |                                       |  |   |    |     |
|---------|-------------------------|---------|---------------------------------------|--|---|----|-----|
| OLI0016 | 2-アセチル<br>-5-メチルフ<br>ラン | OLI0029 | フェニルプロ<br>ピルアルデヒ<br>ド                 |  | x | 0  | 70  |
| OLI0016 | 2-アセチル<br>-5-メチルフ<br>ラン | OLI0021 | 3-ヒドロキシ<br>ヘキサン酸エ<br>チル               |  | x | 10 | 100 |
| OLI0089 | ゲラニルア<br>セトン            | OLI0102 | オイゲノール                                |  | x | 0  | 100 |
| OLI0089 | ゲラニルア<br>セトン            | OLI0093 | ローズマリー<br>油                           |  | x | 0  | 100 |
| OLI0093 | ローズマリ<br>ー油             | OLI0102 | オイゲノール                                |  | x | 0  | 100 |
| OLI0093 | ローズマリ<br>ー油             | OLI0084 | シス-5-オクテ<br>ン-1-オール                   |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0095 | ベラトルアル<br>デヒド                         |  | x | 5  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0080 | 1-オクタノー<br>ル                          |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0083 | 酪酸シス-3-ヘ<br>キセニル                      |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0082 | アルファ, アル<br>ファ-ジメチル<br>フェネチルブ<br>チラート |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0088 | ペンタン酸フ<br>ルフリル                        |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0084 | シス-5-オクテ<br>ン-1-オール                   |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-<br>エニルアセタ<br>ート            |  | x | 0  | 100 |
| OLI0029 | フェニルプロ<br>ピルアル<br>デヒド   | OLI0024 | ガンマ<br>ヘプタラク<br>トン                    |  | x | 0  | 100 |
| OLI0015 | 2, 3-ジメチ<br>ルピラジン       | OLI0024 | ガンマ<br>ヘプタラク<br>トン                    |  | x | 0  | 15  |
| OLI0024 | ガンマ-ヘ<br>プタラク<br>トン     | OLI0021 | 3-ヒドロキシ<br>ヘキサン酸エ<br>チル               |  | x | 0  | 95  |

10

20

30

40

【表 19 - 3】

|         |                  |         |                    |         |                    |   |     |
|---------|------------------|---------|--------------------|---------|--------------------|---|-----|
| OLI0080 | 1-オクタノール         | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 0 | 100 |
| OLI0102 | オイゲノール           | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 0 | 100 |
| OLI0088 | ペンタン酸フルフリル       | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | OLI0102 | オイゲノール             | 0 | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0102 | オイゲノール             | 0 | 85  |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0080 | 1-オクタノール           | 0 | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0088 | ペンタン酸フルフリル         | 0 | 95  |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0080 | 1-オクタノール           | 0 | 100 |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 0 | 35  |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル    | x       |                    | 0 | 5   |

10

20

30

## 実施例 17 . トコジラミの忌避アッセイ

トコジラミ忌避アッセイを用いて、本発明の化合物および化合物の組み合わせを、トコジラミ（キメクス・レクトゥラリウス（*Cimex lectularius*））を忌避する能力についてアッセイした。このアッセイは、トコジラミが避難所を探し求める自然の傾向を利用する。2つのペトリ皿を入手し、それぞれの内部領域にサンドペーパーをかけた（外周は滑らかにしておく）。トコジラミが逃亡するのを防止するために、小さい絵筆でペトリ皿の外周および内壁にタルクを塗布した。ソロバスルームカップ（*solobathroom cup*）の上側を切り落としたものを1つのペトリ皿の中央に逆さまに配置した。大型プラスチックの第2の容器を集め、ペーパータオルを底部の内側に敷いた。次に、ペトリ皿を内側に入れ、10匹のトコジラミをソロカップ（*solocup*）の切り落とした部分の内側に入れた。次に、2片のろ紙を中央で切断し、同じ大きさの半分のろ紙を4枚得た。3片をガラス皿（100cm×50cmまたは90cm×50cm）の内側に入れ、残りの1片を別の皿に入れた。4片の全てを中央で折り畳み、置いたときに折り畳んだ折り目が上に向くように「テント」または「避難所」を作った。100マイクロリットルのイソプロピルアルコールを3片のろ紙（全て第1のガラス皿に収容される）にピペットでたらした。別の4mlのバイアル内で、90マイクロリットルのイソプロピルアルコールを10マイクロリットルの試験中の化合物または化合物の組み合わせと混ぜ合わせ、ボルテックスした。100マイクロリットルのこの溶液 [全部で100mgの化合物を含む] を、別の皿のろ紙にピペットでたらした。次に、全てのろ紙を乾燥さ

40

50

せた。乾燥したら、最初にイソプロピルアルコールのみを含む2枚のろ紙の半分部分（対照実験）、そして次に残りのろ紙の半分部分〔1枚はイソプロピルアルコールのみ、1枚は試験化合物を含む〕を用いて実験を実行した。ろ紙の半分部分を実験用ペトリ皿の両側に置き、トコジラミに皿内を5分間自由に移動させた。各ろ紙のテントの下でのトコジラミの動きを記録した。各試験化合物について得られたデータは表20に記載される。忌避%は、処理したろ紙テントの下方に移動しなかったトコジラミの数を対照と比較した%を表す。表中、「Rep」は忌避を指し、「Cmpd」は化合物を指す。環境に優しい化合物を含む多数の化合物および組み合わせが、驚くべきことに、トコジラミを忌避する強力な能力を示した。いくつかのこのような化合物には、シトロネラ油、オイゲノールおよびゲラニオールが含まれた。

【0160】

【表 20 - 1】

表 20. トコジラミの忌避性

| Cmpd No. | 成分 A                      | Cmpd No. | 成分 B               | % Rep |
|----------|---------------------------|----------|--------------------|-------|
| OLI0065  | トランス-シナムアルデヒド             |          | X                  | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    |          | X                  | 100   |
| OLI0005  | 4-エチルフェノール                |          | X                  | 100   |
| OLI0052  | インドール                     |          | X                  | 100   |
| OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド             |          | X                  | 100   |
| OLI0072  | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン |          | X                  | 100   |
| OLI0067  | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン        |          | X                  | 100   |
| OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル           |          | X                  | 100   |
| OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                |          | X                  | 100   |
| OLI0107  | ギ酸シンナミル                   |          | X                  | 100   |
| OLI0012  | グアヤコール                    |          | X                  | 100   |
| OLI0121  | フェニルアセトアルデヒドジメチルアセタート     |          | X                  | 100   |
| OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン              | OLI0070  | 2-メトキシ-3-メチルピラジン   | 100   |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル               | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル         | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン        | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン    | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン       | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン    | 100   |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン           | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン           | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 100   |
| OLI0093  | ローズマリー油                   | OLI0102  | オイゲノール             | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    | OLI0095  | ベラトルアルデヒド          | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 100   |
| OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン              | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン    | 100   |
| OLI0106  | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール        |          | X                  | 90    |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン       | 88    |

【 0 1 6 1 】

【表 20 - 2】

|         |                          |         |                           |    |    |
|---------|--------------------------|---------|---------------------------|----|----|
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         | OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン           | 88 |    |
| OLI0059 | メチルヘプタジエノン               |         | X                         | 87 |    |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン          |         | X                         | 86 |    |
| OLI0020 | シンナミルニトリル                | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン         | 85 |    |
| OLI0118 | ウルトラズール(Ultrazur (登録商標)) |         | X                         | 84 |    |
| OLI0084 | シス-5-オクテノール-1-オール        |         | X                         | 82 | 10 |
| OLI0093 | ローズマリー油                  | OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール           | 79 |    |
| OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジン            |         | X                         | 77 |    |
| OLI0029 | フェニルプロピルアルデヒド            | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン               | 75 |    |
| OLI0077 | トランス-2-デセナール             |         | X                         | 72 |    |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル              | OLI0077 | トランス-2-デセナール              | 72 |    |
| OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン         | OLI0077 | トランス-2-デセナール              | 72 |    |
| OLI0101 | ペパーミント油                  |         | X                         | 71 | 20 |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン              |         | X                         | 71 |    |
| OLI0114 | トランス-ケイ皮酸メチル             |         | X                         | 70 |    |
| OLI0113 | ケイ皮酸メチル                  |         | X                         | 68 |    |
| OLI0076 | プロピオン酸フェネチル              | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | 65 |    |
| OLI0017 | 2-フリルメチルケトン              |         | X                         | 60 |    |
| OLI0115 | メントール                    |         | X                         | 60 |    |
| OLI0119 | 酪酸ヘキシル                   |         | X                         | 59 |    |
| OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン        |         | X                         | 59 | 30 |
| OLI0110 | ケイ皮酸エチル                  |         | X                         | 59 |    |
| OLI0020 | シンナミルニトリル                |         | X                         | 56 |    |
| OLI0104 | ケイ皮酸アリル                  |         | X                         | 54 |    |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         | OLI0024 | ガンマ-ヘプタラクトン               | 53 |    |
| OLI0028 | フェニルアセトアルデヒド             |         | X                         | 50 |    |
| OLI0002 | 2-エチルピラジン                |         | X                         | 49 |    |
| OLI0079 | チグリン酸 1-エチルヘキシル          |         | X                         | 49 |    |
| OLI0006 | 5-メチルフルフラール              |         | X                         | 47 |    |
| OLI0097 | ギ酸ヘキシル                   |         | X                         | 44 | 40 |
| OLI0016 | 2-アセチル-5-メチルフラン          | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサノ酸エチル           | 43 |    |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         | OLI0015 | 2, 3-ジメチルピラジン             | 43 |    |
| OLI0009 | 2-フロ酸エチル                 |         | X                         | 41 |    |
| OLI0109 | プロピオン酸シンナミル              |         | X                         | 41 |    |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル         | OLI0014 | 2, 3, 5-トリメチルピラジン         | 41 |    |
| OLI0001 | 2, 4-ルチジン                |         | X                         | 39 |    |

【表 20 - 3】

|         |                         |  |   |    |
|---------|-------------------------|--|---|----|
| OL10026 | クロトン酸メチル                |  | X | 38 |
| OL10010 | 乳酸エチル                   |  | X | 37 |
| OL10004 | 2-メチルテトラヒドロフラン<br>-3-オン |  | X | 37 |
| OL10105 | プロピオン酸トランス-シン<br>ナミル    |  | X | 35 |
| OL10066 | バレラルデヒド                 |  | X | 33 |
| OL10071 | 2-エチル-3-メトキシピラジ<br>ン    |  | X | 29 |
| OL10068 | 2,3-ジエチルピラジン            |  | X | 24 |
| OL10112 | メトキシケイ皮酸アルデヒド           |  | X | 23 |
| OL10003 | 2-メトキシピラジン              |  | X | 22 |
| OL10120 | ケイ皮酸ベンジル                |  | X | 21 |
| OL10027 | レブリン酸メチル                |  | X | 20 |
| OL10091 | ヘプタン酸メチル                |  | X | 20 |
| OL10099 | プロピオン酸イソアミル             |  | X | 17 |
| OL10100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル        |  | X | 17 |
| OL10011 | エチルビニルカルビノール            |  | X | 14 |
| OL10111 | メンタラクトン                 |  | X | 13 |
| OL10069 | 2-エチル-3-メチルピラジン         |  | X | 10 |
| OL10019 | 酪酸アリル                   |  | X | 8  |
| OL10092 | メチルアミルケトン               |  | X | 8  |
| OL10096 | ギ酸シス 3-ヘキセニル            |  | X | 6  |
| OL10007 | ギ酸ブチル                   |  | X | 6  |

## 実施例 18 . トコジラミの誘惑アッセイ

化合物および化合物の組み合わせがトコジラミを誘引する能力を測定するためにアッセイを実行した。小型プラスチック容器の試験アリーナ環境をより大きい第2の容器の中に置いた。2つのバスルームサイズのソロカップから上部の約1.3cm(半インチ)を除去し、各カップを試験アリーナ環境の両側に壁から約2.5cm(1インチ)離して置いた。トコジラミは滑らかな表面を上ることができないので、カップの外側部分のそれぞれを、サンドペーパーでざらざらにした。ペーパータオルで試験アリーナ環境の床を覆った。ソロカップの1つの上部の除去した部分を、アリーナの中央に口側を下にして置いた。カップの1つに、コットンボールを入れ、100マイクロリットルの化合物または化合物の組み合わせの溶液[全部で100mgの化合物を含む]で処理した。10匹のトコジラミを中央の切り落とされたカップ上部に配置し、試験アリーナ環境を被覆し、気候が制御された暗室内で一晩おいた。次の日、餌のあるカップ内に入ったトコジラミの数を記録し、トコジラミの総数に対する餌のあるカップ内に入ったトコジラミの割合として誘引%を計算した。試験した各化合物または化合物の組み合わせについて得られたデータは表21に示される。表中、「Att」は誘引を指し、「Compd」は化合物を指す。乳酸エチルおよび/またはシクロペンタノンを含むいくつかの化合物および組み合わせは、驚くべきことに、トコジラミを誘引する強力な能力を示した。

【0163】

【表 2 1】

表 2 1. トコジラミの誘引性

| Cmpd No. | 成分 A             | Cmpd No. | 成分 B                | % Att |
|----------|------------------|----------|---------------------|-------|
| OLI0010  | 乳酸エチル            | OLI0011  | エチルビニルカルビノール        | 80%   |
| OLI0008  | シクロペンタノン         |          | X                   | 50%   |
| OLI0010  | 乳酸エチル            | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 50%   |
| OLI0008  | シクロペンタノン         | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 40%   |
| OLI0010  | 乳酸エチル            | OLI0007  | ギ酸ブチル               | 40%   |
| OLI0007  | ギ酸ブチル            | OLI0008  | シクロペンタノン            | 40%   |
| OLI0007  | ギ酸ブチル            | OLI0003  | 2-メトキシピラジン          | 40%   |
| OLI0018  | 2-ペンタノン          |          | X                   | 30%   |
| OLI0063  | ギ酸プロピル           |          | X                   | 30%   |
| OLI0003  | 2-メトキシピラジン       |          | X                   | 30%   |
| OLI0097  | ギ酸ヘキシル           |          | X                   | 30%   |
| OLI0097  | ギ酸ヘキシル           | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン         | 30%   |
| OLI0025  | メタンチオールアセタート     |          | X                   | 20%   |
| OLI0026  | クロトン酸メチル         |          | X                   | 20%   |
| OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン  | OLI0018  | 2-ペンタノン             | 20%   |
| OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル  | OLI0018  | 2-ペンタノン             | 20%   |
| OLI0010  | 乳酸エチル            | OLI0002  | 2-エチルピラジン           | 20%   |
| OLI0022  | アセト酢酸エチル         | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン         | 20%   |
| OLI0022  | アセト酢酸エチル         | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン     | 20%   |
| OLI0070  | 2-メトキシ-3-メチルピラジン |          | X                   | 10%   |
| OLI0099  | プロピオン酸イソアミル      |          | X                   | 10%   |
| OLI0027  | レブリン酸メチル         |          | X                   | 10%   |
| OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド    | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン         | 10%   |
| OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン  | OLI0028  | フェニルアセトアルデヒド        | 10%   |
| OLI0008  | シクロペンタノン         | OLI0001  | 2,4-ルチジン            | 10%   |
| OLI0007  | ギ酸ブチル            | OLI0004  | 2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン | 10%   |
| OLI0008  | シクロペンタノン         | OLI0022  | アセト酢酸エチル            | 10%   |
| OLI0022  | アセト酢酸エチル         | OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル     | 10%   |

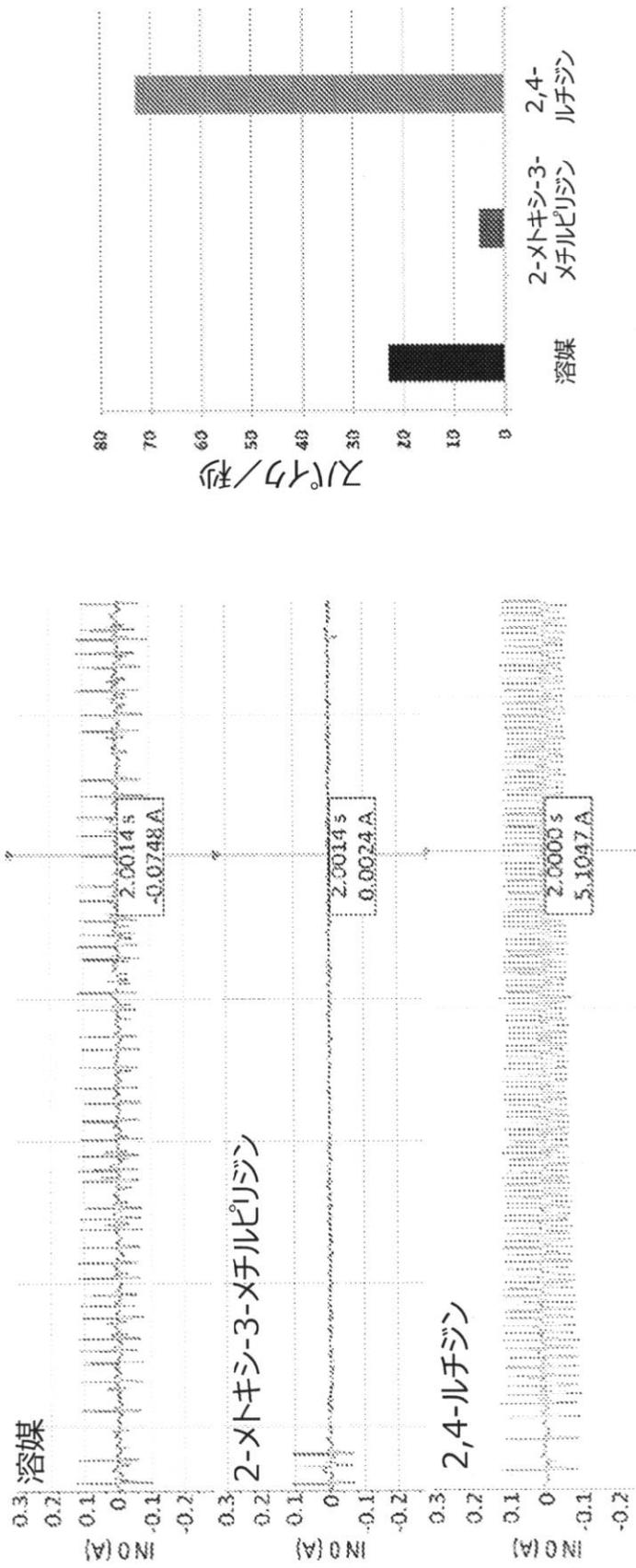
10

20

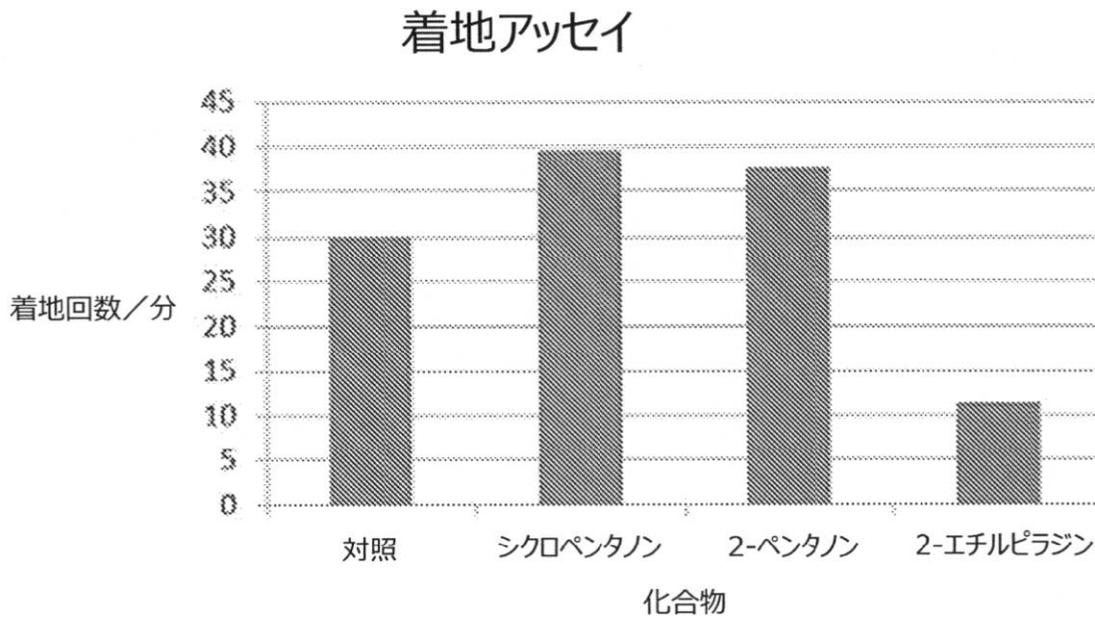
30

40

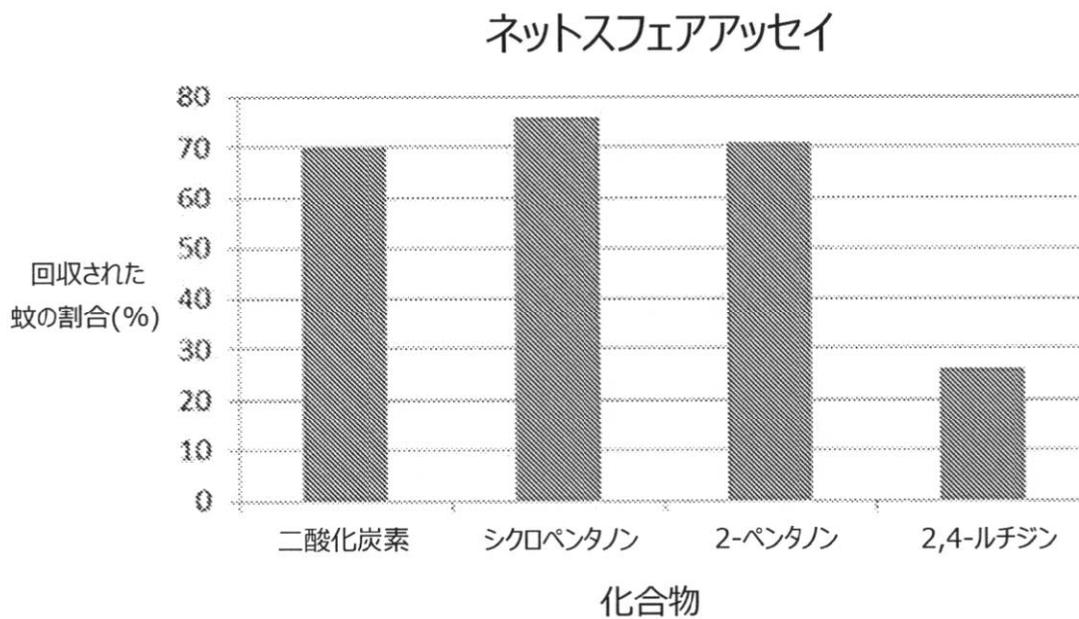
【 図 1 】



【図 2】



【図 3】



【手続補正書】

【提出日】平成27年4月20日(2015.4.20)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

化合物 O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 1 2 1 のうちの少なくとも 1 つを含む組成物。

【請求項 2】

前記組成物が 2 つの化合物の組み合わせを含み、少なくとも 1 つの化合物が、O L I 0 0 0 1 ~ O L I 0 0 0 4、O L I 0 0 0 6 ~ O L I 0 0 0 8、O L I 0 0 1 0、O L I 0 0

11、OLI0013～OLI0015、OLI0017、OLI0018、OLI0020～OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

(a) 少なくとも1つの化合物が、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択されるベータ活性化剤であるか、または

(b) 前記組成物が相乗的な化合物の組み合わせを含み、前記相乗的な化合物の組み合わせの少なくとも1つの化合物が、OLI0014～OLI0018、OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027およびOLI0029からなる群から選択される、

請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

前記組成物が、

(a) OLI0067～OLI0095からなる群から選択される化合物、または

(b) 2つの化合物の組み合わせであって、少なくとも1つの化合物が、OLI0015、OLI0067～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される組み合わせ

を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

請求項4の(b)に記載の特徴を備える請求項4に記載の組成物であって、前記組成物が、

(a) OLI0074、OLI0084およびOLI0100からなる群から選択される少なくとも1つのベータ活性化剤か、

(b) 2つの化合物の組み合わせであって、少なくとも1つの化合物が、OLI0015、OLI0067～OLI0078、OLI0080、OLI0082～OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される組み合わせか、または

(c) OLI0076、OLI0093およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも1つの環境に優しい化合物を含む、組成物。

【請求項6】

媒介有害生物の行動を変更する方法であって、前記媒介有害生物を請求項1に記載の組成物に曝露することを含む方法。

【請求項7】

前記媒介有害生物が、飛行性の双翅類、蚊、スナバエ、ブユ、ツェツェバエ、ヌカカ、トコジラミ、サシガメ、ノミ、シラミ、ダニおよびマダニのうちの少なくとも1つである、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

媒介有害生物の行動を変更することが、

(a) OLI0001～OLI0066からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含む組成物の使用か、

(b) 2つの化合物の組み合わせであって、少なくとも1つの化合物が、OLI0001～OLI0004、OLI0006～OLI0008、OLI0010、OLI0011、OLI0013～OLI0015、OLI0017、OLI0018、OLI0020～OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027、OLI0096、OLI0097およびOLI0099からなる群から選択される組み合わせを含む組成物の使用か、または

(c) OLI0067～OLI0095からなる群から選択される少なくとも1つの化

化合物を含む組成物の使用であって、任意選択により、前記組成物は2つの化合物の組み合わせを含み、前記2つの化合物のうち少なくとも1つがOLI0015、OLI0067~OLI0078、OLI0080、OLI0082~OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される、使用

を含む、請求項7に記載の方法。

【請求項9】

請求項8の(b)に記載の特徴を備える請求項8に記載の方法であって、

(a)各化合物の濃度が少なくとも0.01%であり、任意選択で約0.5%~約5%であるか、または

(b)前記組成物が相乗的な化合物の組み合わせであって、少なくとも1つの化合物がOLI0014~OLI0018、OLI0022、OLI0024、OLI0025、OLI0027およびOLI0029からなる群から選択される組み合わせを含む、方法。

【請求項10】

請求項8の(a)または(c)に記載の特徴を備える請求項8に記載の方法であって、前記飛行性の双翅類が、蚊科(クリキダエ(Culicidae))の1つまたは複数のメンバー(アエデオミヤ(Aedeomyia)属の1つまたは複数のメンバー、アエデス(Aedes)属の1つまたは複数のメンバー(アエデス・アエギプティ(Aedes aegypti)を含むが限定されない)、アノフェレス(Anopheles)属の1つまたは複数のメンバー(アノフェレス・ガンビアエ(Anopheles gambiae)およびアノフェレス・アンヌリペス(Anopheles annulipes)を含むが限定されない)、アルミゲレス(Armigeres)属の1つまたは複数のメンバー、アユラキティア(Ayurakitia)属の1つまたは複数のメンバー、ピロネルラ(Bironella)属の1つまたは複数のメンバー、ポリキンダ(Borichinda)属の1つまたは複数のメンバー、カガシア(Chagasia)属の1つまたは複数のメンバー、コクイルレトティディア(Coquillettidia)属の1つまたは複数のメンバー、クレクス(Culex)属のメンバー(クレクス・クインクエファスキアトゥス(Culex quinquefasciatus)、クレクス・モレストゥス(Culex molestus)、クレクス・アンヌリロストリス(Culex annulirostris)およびクレクス・アウストラリクス(Culex australicus)を含むが限定されない)、クリセタ(Culiseta)属の1つまたは複数のメンバー、デイノケリテス(Deinocerites)属の1つまたは複数のメンバー、エレットマポディテス(Eretmapodites)属の1つまたは複数のメンバー、フィカルビア(Ficalbia)属の1つまたは複数のメンバー、ガリンドミヤ(Galindomyia)属の1つまたは複数のメンバー、ハエマゴグス(Haemagogus)属の1つまたは複数のメンバー、ヘイズマンニア(Heizmannia)属の1つまたは複数のメンバー、ホドゲシア(Hodgesia)属の1つまたは複数のメンバー、イソストミヤ(Isostomyia)属の1つまたは複数のメンバー、ジョンベルキニア(Johnbelkinia)属の1つまたは複数のメンバー、キミア(Kimia)属の1つまたは複数のメンバー、リマトゥス(Limatus)属の1つまたは複数のメンバー、ルトジア(Lutzia)属の1つまたは複数のメンバー、マラヤ(Malaya)属の1つまたは複数のメンバー、マンソニア(Mansonia)属の1つまたは複数のメンバー、マオリゴエルディア(Maorigoeldia)属の1つまたは複数のメンバー、ミモミヤ(Mimomyia)属の1つまたは複数のメンバー、オニリオン(Onirion)属の1つまたは複数のメンバー、オピフェクス(Opifex)属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ(Orthopodomyia)属の1つまたは複数のメンバー、プソロフォラ(Psorophora)属の1つまたは複数のメンバー、ルンコミヤ(Runchomyia)属の1つまたは複数のメンバー、サベテス(Sabethes)属の1つまたは複数のメンバー、シャンノニアナ(S

*hannoniana*) 属の1つまたは複数のメンバー、トボミヤ (*Topomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、トキシリンキテス (*Toxorhynchites*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリコプロソポン (*Trichoprosopon*) 属の1つまたは複数のメンバー、トリプテロイデス (*Tripterooides*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウダヤ (*Udaya*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウラノタエニア (*Uranotaenia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属の1つまたは複数のメンバー、ウィエオミヤ (*Wyeomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー、ゼウグノミヤ (*Zeugomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、グロシナ (*Glossina*) 属のツェツェバエ (グロシナ・アウステニ (*Glossina austeni*)、グロシナ・モルシタンス (*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルリディペス (*Glossina pallidipes*)、グロシナ・スウィンネルトニ (*Glossina swynnertoni*)、グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossina fusca fusca*)、グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fuscipleuris*)、グロシナ・フレジリ (*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトニ (*Glossina haningtoni*)、グロシナ・ロンギペンニス (*Glossina longipennis*)、グロシナ・メディコルム (*Glossina medicorum*)、グロシナ・ナシ (*Glossina nashi*)、グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofusca nigrofusca*)、グロシナ・セヴェリニ (*Glossina severini*)、グロシナ・スクウェツイ (*Glossina schwetzi*)、グロシナ・タバニフォルミス (*Glossina tabaniformis*)、グロシナ・ヴァンホオフィ (*Glossina vanhoeffi*)、グロシナ・カリギネア (*Glossina caliginea*)、グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossina fuscipes fuscipes*)、グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・パルリケラ・パルリケラ (*Glossina pallicera pallicera*)、グロシナ・パルリケラ・ネウステアディ (*Glossina pallicera newsteadii*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis palpalis*)、グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palpalis gambiensis*) およびグロシナ・タキノイデス (*Glossina tachinooides*) を含むが、これらに限定されない) と、ケラトポゴニダエ (*Ceratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属の1つまたは複数のメンバー (クリコイデス・ソノレンシス (*Culicoides sonorensis*) を含むが限定されない)、レプトコノプス (*Leptoconops*) 属の1つまたは複数のメンバー (レプトコノプス・アルビヴェントリス (*Leptoconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Leptoconops torrens*) を含むが限定されない)、およびフォルキボミヤ (*Forcipomyia*) 属の1つまたは複数のメンバーを含むが、これらに限定されない) と、シムリイダエ (*Simuliidae*) 科のブユ (シムリウム (*Simulium*) 属の1つまたは複数のメンバー (シムリウム・ダノスム (*Simulium damnosum*)、シムリウム・ネアヴェイ (*Simulium neavei*)、シムリウム・カルリドゥム (*Simulium callidum*)、シムリウム・メタルリクム (*Simulium metallicum*)、シムリウム・オクラケウム (*Simulium ochraceum*)、シムリウム・コロンバスケンセ (*Simulium colombaschense*)、シムリウム・プリーノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポスティカトゥム (*Simulium posticatum*) を含むが限定されない) を含むが、これらに限定されない) と、スナバエ (ルツオミヤ (*Lutzomyia*) 属の1つまたは複数のメンバー (ルツオミヤ・ロンギパルピス (*Lutzomyia longipalpis*) を含むが限定されない)、および

フレボトムス ( Phlebotomus ) 属の1つまたは複数のメンバー ( フレボトムス・パパタスイ ( Phlebotomus papatasi ) を含むが限定されない ) を含むが、これらに限定されない ) とからなる群から選択される、方法。

【請求項11】

各化合物の濃度が少なくとも0.01%であり、任意選択で約0.01%~約5%である、請求項8に従属するとともに請求項8の(c)に記載の特徴を備える請求項10に記載の方法。

【請求項12】

前記媒介有害生物がトコジラミであり、前記組成物が、

(i) OLI0005、OLI0012、OLI0015~OLI0017、OLI0021、OLI0024、OLI0029、OLI0052、OLI0059、OLI0065、OLI0067、OLI0072、OLI0074、OLI0077、OLI0084、OLI0101、OLI0102、OLI0106、OLI0107、OLI0113~OLI0115、OLI0118およびOLI0121からなる群から選択される1つのトコジラミ忌避化合物が、

(ii) トコジラミ忌避性の2つの化合物の組み合わせであって、

(a) OLI0014~OLI0017、OLI0020、OLI0024、OLI0029およびOLI0102からなる群から選択されるか、またはOLI0015、OLI0067~OLI0078、OLI0080、OLI0082~OLI0084、OLI0089、OLI0093、OLI0095、OLI0100およびOLI0102からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含むか、

(b) OLI0017と、OLI0014およびOLI0015のうちから選択される化合物とを含むか、または

(c) OLI0020およびOLI0029を含む、組み合わせか、あるいは

(iii) OLI0007、OLI0008およびOLI0010からなる群から選択される少なくとも1つの化合物を含む、請求項7に記載の方法。

【請求項13】

媒介有害生物を殺す方法であって、前記媒介有害生物を請求項1に記載の組成物に曝露することを含む方法。

【請求項14】

化合物OLI0001~OLI0102のうちの少なくとも1つを含むパッチであって、前記パッチが任意選択で、紙、プラスチック、金属、布帛、ワックス、高分子材料、ポリエチレン、ポリプロピレン、ゴム、セルロース、シリコンゴムおよびセルロースベースの材料からなる群から選択される1つまたは複数の材料で構成され、前記パッチは前記1つまたは複数の材料に加え、さらに任意選択で

(a) 約1cm<sup>2</sup>~約5cm<sup>2</sup>の面積、

(b) 円形、正方形、矩形、三角形および多角形からなる群から選択される形状、および

(c) 任意選択で接着剤を含む、パッチ。

【請求項15】

請求項14に記載のパッチを含む、媒介有害生物の忌避方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0144

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0144】

【表 16 - 2】

|         |                  |                      |         |                  |           |         |                           |                      |     |
|---------|------------------|----------------------|---------|------------------|-----------|---------|---------------------------|----------------------|-----|
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv             | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | Strng Inh | OLI0074 | ペンタン酸フルフリル                | ベータ Actv および Mod Inh | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | ベータ Actv             | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | Strng Inh | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート        | 穏やかな Inh             | 96  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0102 | オイゲノール           | 穏やかな Inh  | X       |                           |                      | 72  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0076 | プロピオン酸フェネチル      | Mod Inh   | X       |                           |                      | 57  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh   | X       |                           |                      | 79  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh   | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン              | Strng Inh            | 100 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh   | OLI0072 | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン | Mod Inh              | 93  |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | ベータ Actv および Mod Inh | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン | Mod Inh   | OLI0102 | オイゲノール                    | 穏やかな Inh             | 98  |
| OLI0084 | シス-5-オクテン-1-オール  | ベータ Actv および穏やかな Inh | OLI0102 | オイゲノール           | 穏やかな Inh  | X       |                           |                      | 77  |

## 実施例 12 . エリア行動アッセイ

本発明の化合物および組成物の評価に役立つための行動アッセイを開発した。これらのアッセイには、着地アッセイおよびネットスフェアアッセイが含まれる。これらのアッセイを用いて、アエデス・アエギプティ (*Aedes aegypti*) 種の蚊の誘引または忌避に関する前記化合物および組成物の有効性を決定した。双翅 (*Diptera*) 目の全体にわたる二酸化炭素受容体の高度な保存性のために、アエデス・アエギプティ (*A*

e d e s a e g y p t i ) に対して得られる結果は、蚊科（クリキダエ（C u l i c i d a e ））の他のメンバーに関して、および他の双翅類のメンバーに関して、直観的な知識である可能性が高い。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0157

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0157】

【表 19 - 1】

表 19. 組み合わせの殺生物活性

| Cmpd No. | Comp A           | Cmpd No. | Comp B                      | Cmpd No. | Comp C | 0.2 mg/ml による Mort% | 2.0 mg/ml による Mort% |
|----------|------------------|----------|-----------------------------|----------|--------|---------------------|---------------------|
| OLI0092  | メチルアミルケトン        | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン                 |          | x      | 0                   | 5                   |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                  |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン            |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピラジン |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル      | OLI0077  | トランス-2-デセナール                |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                  |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0077  | トランス-2-デセナール                |          | x      | 65                  | 100                 |
| OLI0071  | 2-エチル-3-メトキシピラジン | OLI0072  | 2-メトキシ-3(5 または 6)イソプロピルピラジン |          | x      | 0                   | 45                  |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン                 |          | x      | 0                   | 95                  |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド               |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン                |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン             |          | x      | 0                   | 100                 |
| OLI0020  | シンナミルニトリル        | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン                 |          | x      | 0                   | 100                 |

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0158

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0158】

【表 19 - 2】

|         |                         |         |                                       |  |   |    |     |
|---------|-------------------------|---------|---------------------------------------|--|---|----|-----|
| OLI0016 | 2-アセチル<br>-5-メチルフ<br>ラン | OLI0029 | フェニルプロ<br>ピルアルデヒ<br>ド                 |  | x | 0  | 70  |
| OLI0016 | 2-アセチル<br>-5-メチルフ<br>ラン | OLI0021 | 3-ヒドロキシ<br>ヘキサン酸エ<br>チル               |  | x | 10 | 100 |
| OLI0089 | ゲラニルア<br>セトン            | OLI0102 | オイゲノール                                |  | x | 0  | 100 |
| OLI0089 | ゲラニルア<br>セトン            | OLI0093 | ローズマリー<br>油                           |  | x | 0  | 100 |
| OLI0093 | ローズマリ<br>ー油             | OLI0102 | オイゲノール                                |  | x | 0  | 100 |
| OLI0093 | ローズマリ<br>ー油             | OLI0084 | シス-5-オクテ<br>ン-1-オール                   |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0095 | ベラトルアル<br>デヒド                         |  | x | 5  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0080 | 1-オクタノー<br>ル                          |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0083 | 酪酸シス-3-ヘ<br>キセニル                      |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0082 | アルファ, アル<br>ファ-ジメチル<br>フェネチルブ<br>チラート |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0074 | ペンタン酸フ<br>ルフリル                        |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0084 | シス-5-オクテ<br>ン-1-オール                   |  | x | 0  | 100 |
| OLI0102 | オイゲノー<br>ル              | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-<br>エニルアセタ<br>ート            |  | x | 0  | 100 |
| OLI0029 | フェニルプ<br>ロピルアル<br>デヒド   | OLI0024 | ガンマ<br>ヘプタラクト<br>ン                    |  | x | 0  | 100 |
| OLI0015 | 2, 3-ジメチ<br>ルピラジン       | OLI0024 | ガンマ<br>ヘプタラクト<br>ン                    |  | x | 0  | 15  |
| OLI0024 | ガンマ-ヘプ<br>タラクトン         | OLI0021 | 3-ヒドロキシ<br>ヘキサン酸エ<br>チル               |  | x | 0  | 95  |

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 1 5 9

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 1 5 9 】

【表 1 9 - 3】

|         |                  |         |                    |         |                    |   |     |
|---------|------------------|---------|--------------------|---------|--------------------|---|-----|
| OLI0080 | 1-オクタノール         | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 0 | 100 |
| OLI0102 | オイゲノール           | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | 0 | 100 |
| OLI0074 | ペンタン酸フルフリル       | OLI0071 | 2-エチル-3-メトキシピラジン   | OLI0102 | オイゲノール             | 0 | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0102 | オイゲノール             | 0 | 85  |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0080 | 1-オクタノール           | 0 | 100 |
| OLI0100 | (E)-ヘキサ-3-エン酸メチル | OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン       | OLI0074 | ペンタン酸フルフリル         | 0 | 95  |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0080 | 1-オクタノール           | 0 | 100 |
| OLI0068 | 2,3-ジエチルピラジン     | OLI0102 | オイゲノール             | OLI0078 | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 0 | 35  |
| OLI0022 | アセト酢酸エチル         | OLI0021 | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル    |         | x                  | 0 | 5   |

## 実施例 17 . トコジラミの忌避アッセイ

トコジラミ忌避アッセイを用いて、本発明の化合物および化合物の組み合わせを、トコジラミ(キメクス・レクトゥラリウス(*Cimex lectularius*))を忌避する能力についてアッセイした。このアッセイは、トコジラミが避難所を探し求める自然の傾向を利用する。2つのペトリ皿を入手し、それぞれの内部領域にサンドペーパーをかけた(外周は滑らかにしておく)。トコジラミが逃亡するのを防止するために、小さい絵筆でペトリ皿の外周および内壁にタルクを塗布した。ソロバスルームカップ(*solobathroom cup*)の上側を切り落としたものを1つのペトリ皿の中央に逆さまに配置した。大型プラスチックの第2の容器を集め、ペーパータオルを底部の内側に敷いた。次に、ペトリ皿を内側に入れ、10匹のトコジラミをソロカップ(*solocup*)の切り落とした部分の内側に入れた。次に、2片のろ紙を中央で切断し、同じ大きさの半分のろ紙を4枚得た。3片をガラス皿(100cm×50cmまたは90cm×50cm)の内側に入れ、残りの1片を別の皿に入れた。4片の全てを中央で折り畳み、置いたときに折り畳んだ折り目が上に向くように「テント」または「避難所」を作った。100

マイクロリットルのイソプロピルアルコールを3片のろ紙（全て第1のガラス皿に収容される）にピペットでたらした。別の4mlのバイアル内で、90マイクロリットルのイソプロピルアルコールを10マイクロリットルの試験中の化合物または化合物の組み合わせと混ぜ合わせ、ボルテックスした。100マイクロリットルのこの溶液〔全部で100mgの化合物を含む〕を、別の皿のろ紙にピペットでたらした。次に、全てのろ紙を乾燥させた。乾燥したら、最初にイソプロピルアルコールのみを含む2枚のろ紙の半分部分（対照実験）、そして次に残りのろ紙の半分部分〔1枚はイソプロピルアルコールのみ、1枚は試験化合物を含む〕を用いて実験を実行した。ろ紙の半分部分を実験用ペトリ皿の両側に置き、トコジラミに皿内を5分間自由に移動させた。各ろ紙のテントの下でのトコジラミの動きを記録した。各試験化合物について得られたデータは表20に記載される。忌避%は、処理したろ紙テントの下方に移動しなかったトコジラミの数を対照と比較した%を表す。表中、「Rep」は忌避を指し、「Compd」は化合物を指す。環境に優しい化合物を含む多数の化合物および組み合わせが、驚くべきことに、トコジラミを忌避する強力な能力を示した。いくつかのこのような化合物には、シトロネラ油、オイゲノールおよびゲラニオールが含まれた。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0160

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0160】

【表 20 - 1】

表 20. トコジラミの忌避性

| Cmpd No. | 成分 A                      | Cmpd No. | 成分 B               | % Rep |
|----------|---------------------------|----------|--------------------|-------|
| OLI0065  | トランス-シンナムアルデヒド            |          | X                  | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    |          | X                  | 100   |
| OLI0005  | 4-エチルフェノール                |          | X                  | 100   |
| OLI0052  | インドール                     |          | X                  | 100   |
| OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド             |          | X                  | 100   |
| OLI0072  | 2-メトキシ-3(5または6)イソプロピルピラジン |          | X                  | 100   |
| OLI0067  | 2,3-ジエチル-5-メチルピラジン        |          | X                  | 100   |
| OLI0021  | 3-ヒドロキシヘキサン酸エチル           |          | X                  | 100   |
| OLI0074  | ペンタン酸フルフリル                |          | X                  | 100   |
| OLI0107  | ギ酸シンナミル                   |          | X                  | 100   |
| OLI0012  | グアヤコール                    |          | X                  | 100   |
| OLI0121  | フェニルアセトアルデヒドジメチルアセタール     |          | X                  | 100   |
| OLI0068  | 2,3-ジエチルピラジン              | OLI0070  | 2-メトキシ-3-メチルピラジン   | 100   |
| OLI0076  | プロピオン酸フェネチル               | OLI0074  | ペンタン酸フルフリル         | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0017  | 2-フリルメチルケトン        | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン    | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン       | 100   |
| OLI0017  | 2-フリルメチルケトン               | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン    | 100   |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン           | OLI0029  | フェニルプロピルアルデヒド      | 100   |
| OLI0016  | 2-アセチル-5-メチルフラン           | OLI0024  | ガンマ-ヘプタラクトン        | 100   |
| OLI0093  | ローズマリー油                   | OLI0102  | オイゲノール             | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    | OLI0095  | ベラトルアルデヒド          | 100   |
| OLI0102  | オイゲノール                    | OLI0078  | (Z)-ヘプタ-3-エニルアセタート | 100   |
| OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン              | OLI0014  | 2,3,5-トリメチルピラジン    | 100   |
| OLI0106  | ケイ皮酸アルデヒドジメチルアセタール        |          | X                  | 90    |
| OLI0020  | シンナミルニトリル                 | OLI0015  | 2,3-ジメチルピラジン       | 88    |

【国際調査報告】

61500390014



PCT/US2013/055330 18.03.2014

## PATENT COOPERATION TREATY

## PCT

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

|   |  |   |
|---|--|---|
| Applicant's or agent's file reference<br>20361000PCT2 | <b>FOR FURTHER ACTION</b>  | see Form PCT/ISA/220<br>as well as, where applicable, item 5 below.               |
| International application No.<br>PCT/US13/55330       | International filing date ( <i>day/month/year</i> )<br>16 August 2013 (16.08.2013) | (Earliest) Priority Date ( <i>day/month/year</i> )<br>17 August 2012 (17.08.2012) |
| Applicant<br>Ofactor Laboratories Incorporated        |  |   |

This international search report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This international search report consists of a total of 5 sheets.

It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

## 1. Basis of the report

a. With regard to the language, the international search was carried out on the basis of:

- the international application in the language in which it was filed.  
 a translation of the international application into \_\_\_\_\_ which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1(b)).

b.  This international search report has been established taking into account the rectification of an obvious mistake authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43.6bis(a)).

c.  With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, see Box No. I.

2.  Certain claims were found unsearchable (see Box No. II).

3.  Unity of invention is lacking (see Box No. III).

4. With regard to the title,

- the text is approved as submitted by the applicant.  
 the text has been established by this Authority to read as follows:

THE ATTRACTION AND REPULSION OF INSECTS

5. With regard to the abstract,

- the text is approved as submitted by the applicant.  
 the text has been established, according to Rule 38.2, by this Authority as it appears in Box No. IV. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority.

6. With regard to the drawings,

- a. the figure of the drawings to be published with the abstract is Figure No. 1  
 as suggested by the applicant.  
 as selected by this Authority, because the applicant failed to suggest a figure.  
 as selected by this Authority, because this figure better characterizes the invention.
- b.  none of the figures is to be published with the abstract.

17. 6. 2015

PCT/US2013/055330 18.03.2014

2

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US13/55330

**Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

This application contains the following inventions or groups of inventions which are not so linked as to form a single general inventive concept under PCT Rule 13.1. In order for all inventions to be examined, the appropriate additional examination fees must be paid.

Group I\*: Claims 1-85, Compound OLI0001 are directed toward a composition, methods, and a device comprising the Compound OLI0001.

Exemplary Election for Group I\*: Compound OLI0002.

\*\*\*Continued Within the Next Supplemental Box.\*\*\*

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:  
Claims 1-85, Compound OLI0001

**Remark on Protest**

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

PCT/US2013/055330 18.03.2014 3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/US13/55330

|  |  |  |
|--|--|--|
| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>IPC(8) - A01N 25/00, 43/00 (2014.01)<br>USPC - 504/116.1, 209<br>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC   |  |  |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>IPC(8) - A01N 25/00, 43/00 (2014.01)<br>USPC - 504/116.1, 209<br><br>Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched<br><br>Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)<br>MicroPatent (US-G, US-A, EP-A, EP-B, WO, JP-bib, DE-C,B, DE-A, DE-T, DE-U, GB-A, FR-A); Google Scholar; IP.com; ProQuest Dialog; Google; 2-ethylpyrazine, 2-methoxypyrazine, 5-methyl furfural, ethylvinylcarbinol, trans-2-methyl-2-butenal, 2,3,5-trimethylpyrazine, 2-furyl methyl ketone, cinnamyl nitrile, gamma-heptalactone, methanethiol acetate |  |  |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>  |  |  |
| Category*  | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No.  |
| X<br>—<br>Y  | US 2011/0009264 A1 (HACKER, E et al.) 13 January 2011; paragraphs [0027], [0035], [0046], [0150], [0184], [0187]   | 1-7, 13, 73<br>—<br>65-70, 71/69-71/70,<br>72/71/69-72/71/70, 74-80,<br>81/73, 81/77, 81/80,<br>82/81/73, 82/81/77,<br>82/81/80, 83/81/73,<br>83/81/77, 83/81/80,<br>84/83/81/73, 84/83/81/77,<br>84/83/81/80,<br>85/84/83/81/73,<br>85/84/83/81/77,<br>85/84/83/81/80 |
| —<br>A   |  | 28-34, 35/31, 35/34, 41,<br>47-48, 59-61, 63   |
| Y  | WO 02/067680 A1 (DELONG, MA et al.) 06 September 2002; abstract; page 6, last paragraph – page 7, first paragraph; table 2; claim 6  | 65-70, 71/69-71/70,<br>72/71/69-72/71/70   |
| Y  | US 5,343,853 A (ITZEL, H et al.) 06 September 1994; abstract; figures 1, 3; column 2, lines 31-44; column 5, lines 44-50; column 6, lines 20-25  | 74-80, 81/73, 81/77,<br>81/80, 82/81/73,<br>82/81/77, 82/81/80,<br>83/81/73, 83/81/77,<br>83/81/80,<br>—***-Continued<br>within the Next Box-***   |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/>  |  |  |
| * Special categories of cited documents:   |  |  |
| "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance   | "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  |  |
| "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date  | "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   |  |
| "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)  | "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 |  |
| "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means   | "Δ" document member of the same patent family  |  |
| "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed   |  |  |
| Date of the actual completion of the international search<br>24 February 2014 (24.02.2014)   | Date of mailing of the international search report<br><b>18 MAR 2014</b>   |  |
| Name and mailing address of the ISA/US<br>Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents<br>P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450<br>Facsimile No. 571-273-3201  | Authorized officer:<br>Shane Thomas<br><br>PCT Helpdesk: 571-272-4300<br>PCT QSP: 571-272-7774   |  |

PCT/US2013/055330 18.03.2014 4

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US13/55330

| C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT |   |  |
|---|---|--|
| Category*   | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No.  |
|   |   | -***-Continued from the Previous Box-***<br>84/83/81/73, 84/83/81/77,<br>84/83/81/80,<br>85/84/83/81/73,<br>85/84/83/81/77,<br>85/84/83/81/80  |
| Y   | US 2004/0124254 A1 (HARADA, S et al.) 01 July 2004; abstract; paragraphs [0001], [0015]   | 81/73, 81/77, 81/80,<br>82/81/73, 82/81/77,<br>82/81/80, 83/81/73,<br>83/81/77, 83/81/80,<br>84/83/81/73, 84/83/81/77,<br>84/83/81/80,<br>85/84/83/81/73,<br>85/84/83/81/77,<br>85/84/83/81/80 |
| Y   | PARNELL, IW et al. Some Observations on the Lethal Effects of Various Chemicals Against the Free-living Stages of Sclerostomes (Nematoda). Brit. J. Pharmacol., 1952, Vol. 7, pp. 509-533 [online], [retrieved on 2013-12-19]. Retrieved from the Internet <URL: <a href="http://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1111/j.1476-5381.1952.tb00718.x/pdf">http://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1111/j.1476-5381.1952.tb00718.x/pdf</a> >; page 517, line 45 | 71/69-71/70,<br>72/71/69-72/71/70  |
| A   | US 2011/0077248 A1 (VU, CB et al.) 31 March 2011; paragraphs [0127]-[0128], [0353]  | 28-34, 35/31, 35/34, 41,<br>47-48, 59-61, 63   |
| A   | TURNER, SL et al. Ultra-Prolonged Activation of CO <sub>2</sub> -Sensing Neurons Disorients Mosquitoes. Nature, 02 June 2011, Vol. 474, No. 7348, pp. 87-91 [online], [retrieved on 2013-12-19]. Retrieved from the Internet <URL: <a href="http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3150595/pdf/nihms313006.pdf">http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3150595/pdf/nihms313006.pdf</a> > <DOI: 10.1038/nature10081>; page 3, last paragraph   | 28-34, 35/31, 35/34, 41,<br>47-48, 59-61, 63   |

PCT/US2013/055330 18.03.2014

5  
J

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US13/55330

-----Continued from Box No. III: Observations where unity of invention is lacking-----

Group I+ will be searched to the extent that it encompasses the first named invention (Compound OLI0001, and the methods and device utilizing Compound OLI0001), without fee. It is believed that Claims 1-7, 13, 28-35, 41, 47-48, 59-61, 63, and 65-65 encompass this first named invention. An Exemplary Election for further search of Group I+ would be to elect Compound OLI0002. Applicants must indicate, if applicable, the claims which encompass the first named invention if different than what was indicated above for this group. Failure to clearly identify how any paid additional invention fees are to be applied to the "+" group will result in only the first claimed invention to be searched/examined.

The common technical features of the claims of Group I+, include utilizing Group I+ compounds in a composition, a method of modifying the behavior, or killing, of a vector pest comprising exposing said vector pest to a composition including a Group I+ compound, and a device comprising a Group I+ compound.

These common technical features are disclosed by US 2010/0140368 A1 to de Lame, et al. (hereinafter 'de Lame'). De Lame discloses a composition (foaming insecticidal ant spray; abstract) comprising a Group I+ compound (composition contains synergist including OLI0012, guaiacol; OLI0018, 2-pentanone; OLI0028, phenylacetaldehyde; OLI0044, ethylformate; OLI0047, ethyllevulinate; OLI0049, heptaldehyde; OLI0050, heptanone; OLI0085, trans-cinnamaldehyde; OLI0087, Eucalyptol; OLI0093, rosemary oil; OLI0095, veratraldehyde; OLI0101, peppermint oil; paragraphs [0012], [0020], [0047]; claim 6), a method of modifying the behavior, or killing, of a vector pest (method for killing and controlling ants; abstract) comprising exposing said vector pest to a composition including a Group I+ compound (composition is foamed directly onto the ants whereby the ants become entangled within the foam, increase their contact time with the compositions, and perish; abstract), and a device comprising a Group I+ compound (a dispensing system further comprising a container equipped with a foaming trigger sprayer; claim 9).

Alternately, these common technical features lack an inventive step under PCT Article 33(3) as being obvious over US 2011/0009264 A1 to Hacker, et al. (hereinafter 'Hacker').

Hacker discloses a composition (herbicide as a composition; paragraph [0027]) comprising at least one of compounds OLI0001' (2,4-lutidine) (2,4-dimethylpyridine (compound A-29); paragraphs [0027], [0035]; Table A); wherein the composition is coupled with an insecticide (herbicide combinations according to the invention may furthermore comprise agrochemically active compounds, including insecticides, and additives customary in crop protection (protection from insects); paragraphs [0093], [0142], [0185]-[0186]) and exposing the pests to the composition (application (exposing) is carried out by spraying, watering, or broadcasting; paragraph [0187]); and a device comprising a Group I+ compound (application (exposing) is carried out by mixing in a tank (device), and spraying, watering, or broadcasting; paragraph [0187], [0188]). Hacker does not disclose modifying the behavior, or killing, of a vector pest. It would have been obvious to a person of ordinary skill in the art, at the time of the invention, to have modified the composition, as previously disclosed by Hacker, in order to have provided a method of modifying the behavior, or killing, a vector pest for the advantage of killing insects as well as weeds, and for the advantage of protecting desired crops from undesired pests. Additionally, where Hacker discloses addition of an insecticide to the composition (paragraphs [0093], [0142], [0185]-[0186]), the modification of modifying the behavior, or killing, a vector pest through exposure could have been readily achieved through routine experimentation and testing, provided the previous disclosure of Hacker.

Since the common technical features are previously disclosed by de Lame, or alternately rendered obvious by Hacker, these common features are not special and so Group I+ lack unity.

## フロントページの続き

| (51)Int.Cl.             | F I           | テーマコード(参考) |
|-------------------------|---------------|------------|
| A 0 1 N 35/06 (2006.01) | A 0 1 N 37/02 |            |
| A 0 1 N 37/06 (2006.01) | A 0 1 N 35/06 |            |
| A 0 1 N 31/02 (2006.01) | A 0 1 N 43/08 | F          |
| A 0 1 N 31/16 (2006.01) | A 0 1 N 37/06 |            |
| A 0 1 N 35/02 (2006.01) | A 0 1 N 31/02 |            |
| A 0 1 N 37/34 (2006.01) | A 0 1 N 31/16 |            |
| A 0 1 N 37/42 (2006.01) | A 0 1 N 35/02 |            |
| A 0 1 N 35/04 (2006.01) | A 0 1 N 37/34 | 1 0 9      |
| A 0 1 N 37/04 (2006.01) | A 0 1 N 37/42 |            |
| A 0 1 N 31/06 (2006.01) | A 0 1 N 35/04 |            |
| A 0 1 N 65/22 (2009.01) | A 0 1 N 37/04 |            |
| A 0 1 P 17/00 (2006.01) | A 0 1 N 43/40 | 1 0 1 D    |
| A 0 1 P 7/04 (2006.01)  | A 0 1 N 31/06 |            |
| A 0 1 N 43/38 (2006.01) | A 0 1 N 65/22 |            |
| A 0 1 M 1/02 (2006.01)  | A 0 1 P 17/00 |            |
| A 0 1 M 1/20 (2006.01)  | A 0 1 P 7/04  |            |
| A 0 1 M 29/12 (2011.01) | A 0 1 N 43/38 |            |
|                         | A 0 1 M 1/02  | A          |
|                         | A 0 1 M 1/20  | A          |
|                         | A 0 1 M 29/12 |            |

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, T M), EP(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, R S, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), 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, H R, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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

(72)発明者 ブラウン、ミシェル アーデラ  
アメリカ合衆国 9 2 5 4 5 カリフォルニア州 ヘメット アンカレッジ ストリート 3 8 7  
0

(72)発明者 ロメリ、マルティン アントニオ ジュニア  
アメリカ合衆国 9 2 5 5 3 カリフォルニア州 モレノ バレー ブルーリーフ ストリート  
2 5 9 3 3

(72)発明者 エルカーシフ、サメル  
アメリカ合衆国 9 2 5 5 7 カリフォルニア州 モレノ バレー タートン レーン 1 2 1 9  
4

(72)発明者 ジオン、トリシア  
アメリカ合衆国 9 2 6 7 9 カリフォルニア州 トラブーコ キャニオン シャドウ ロック  
レーン 2 0 7 2 1

(72)発明者 フルトス、ウリセス  
アメリカ合衆国 9 2 3 2 4 カリフォルニア州 コルトン マルチネス レーン 1 2 2 9

Fターム(参考) 2B121 AA11 AA12 CA52 CA53 CA54 CA64 CC02 CC11 CC22 CC27  
CC31  
4H011 AC01 AC07 BA06 BB03 BB05 BB06 BB08 BB09 BB22 DA07  
DF04