

(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)
<b>AO 1 N 43/40 (2006. 01)</b>	AO 1 N 43/40	1 O 1 A
<b>AO 1 N 43/60 (2006. 01)</b>	AO 1 N 43/60	2 B 1 2 1
<b>AO 1 N 43/08 (2006. 01)</b>	AO 1 N 43/08	H
<b>AO 1 N 31/08 (2006. 01)</b>	AO 1 N 31/08	
<b>AO 1 N 37/02 (2006. 01)</b>	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)	(71) 出願人	515042971
(86) (22) 出願日	平成25年8月16日 (2013. 8. 16)		オルファクター ラボラトリーズ インコーポレイテッド
(85) 翻訳文提出日	平成27年2月27日 (2015. 2. 27)		OLFACTOR LABORATORIES, INC.
(86) 国際出願番号	PCT/US2013/055330		アメリカ合衆国 92507 カリフォルニア州 リバーサイド スプリングス ストリート 1650 フィフス フロア
(87) 国際公開番号	W02014/028835	(74) 代理人	100105957
(87) 国際公開日	平成26年2月20日 (2014. 2. 20)		弁理士 恩田 誠
(31) 優先権主張番号	61/684, 242	(74) 代理人	100068755
(32) 優先日	平成24年8月17日 (2012. 8. 17)		弁理士 恩田 博宣
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100142907
(31) 優先権主張番号	61/805, 172		弁理士 本田 淳
(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)		

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。

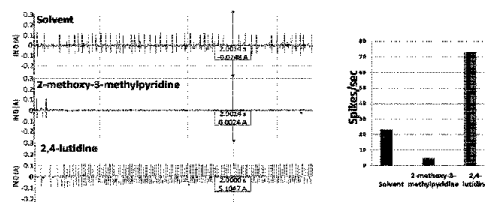


FIG. 1

## 【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、O L I 0 0 1 5、O L I 0 0 6 7 ~ O L I 0 0 7 8、O L I 0 0 8 0、O L I 0 0 8 2 ~ O L I 0 0 8 4、O L I 0 0 8 9、O L I 0 0 9 3、O L I 0 0 9 5、O L I 0 1 0 0 および O L I 0 1 0 2 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 . 0 1 % 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 . 0 1 % ~ 約 5 % である、請求項 14 に記載の組成物。

10

【請求項 20】

前記組成物が、O L I 0 0 7 4、O L I 0 0 8 4 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、O L I 0 0 7 6、O L I 0 0 9 3 および O L I 0 1 0 2 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。

20

【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、O L I 0 0 6 8、O L I 0 0 7 1、O L I 0 0 7 2、O L I 0 0 7 4、O L I 0 0 7 8、O L I 0 0 8 0、O L I 0 1 0 0 および O L I 0 1 0 2 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、O L I 0 0 7 6、O L I 0 0 9 3 および O L I 0 1 0 2 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、O L I 0 0 7 4 および 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を含む、請求項 23 に記載の組成物。

30

【請求項 26】

前記相乗的な組み合わせが、O L I 0 0 7 1、O L I 0 0 9 3 および O L I 0 1 0 2 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、O L I 0 0 1 5、O L I 0 0 7 2 ~ O L I 0 0 7 8、O L I 0 0 8 0、O L I 0 0 8 2 ~ O L I 0 0 8 4、O L I 0 0 8 9、O L I 0 0 9 5 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 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。

40

【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 C O <sub>2</sub> 応答性ニューロン活性および C O <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。

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 ( 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 ( *Bironeilla* ) 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・キ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 ( *Manson* ) 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

20

30

40

50



バー、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 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 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 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  
*iae*) 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 (*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・キ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 40  
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・スクウェツィ (*Glossina schweitzii*)、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 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・ブルイノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium posticum*) 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 (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 (*Bironeilla*) 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、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  
 バー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャannoniana (*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*) 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 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 newstead*  
*i*)、グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis pa*  
*lpalis*)、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・ブルイノスム (*Simulium pruinosum*) およびシムリウム・ポストイカトゥム (*Simulium postic* 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(*Bironeilla*)属の1つまたは複数のメンバー、ボリキンダ(*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・キ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、ジョンベルキンニア(*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 (*O  
 pifex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomy  
 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  
 バー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャannon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 10  
 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 (*V  
 errallina*) 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 (*Gl  
 ossina swynnertoni*), グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossin  
 a fusca fusca*), グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fu  
 scipleuris*), 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  
 ギベンニス (*Glossina longipennis*), グロシナ・メディコルム (*G  
 lossina medicorum*), グロシナ・ナシ (*Glossina nas  
 hi*), グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofus  
 ca nigrofusca*), グロシナ・セヴェリニ (*Glossina sever  
 ini*), 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 vanhoofti*), グロシナ・カリギネア (*Glos  
 sina caliginea*), グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossin  
 a fuscipes fuscipes*), グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*G  
 lossina 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 newstead  
 i*), グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis pa  
 lpalis*), グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palp  
 alis 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 (*C  
 eratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属 40  
 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 s  
 onorensis*) を含むが限定されない), レプトコノプス (*Leptoco  
 nops*) 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 (*Lept  
 oconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Lept  
 oconops torrens*) を含むが限定されない), およびフォルキボミヤ (*F  
 orcipomyia*) 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 dam  
 nosum*), 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 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・ブルイノスム(*Simulium pruinosum*)およびシムリウム・ポスティカトゥム(*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、ボリキンダ(*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、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*

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 (*O  
 pifex*) 属の1つまたは複数のメンバー、オルトポドミヤ (*Orthopodomy  
 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  
 バー、サベテス (*Sabethes*) 属の1つまたは複数のメンバー、シャannon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 10  
 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 (*V  
 errallina*) 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 (*Gl  
 ossina swynnertoni*), グロシナ・フスカ・フスカ (*Glossin  
 a fusca fusca*), グロシナ・フスキブレウリス (*Glossina fu  
 scipleuris*), 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  
 ギベンニス (*Glossina longipennis*), グロシナ・メディコルム (*G  
 lossina medicorum*), グロシナ・ナシ (*Glossina nas  
 hi*), グロシナ・ニグロフスカ・ニグロフスカ (*Glossina nigrofus  
 ca nigrofusca*), グロシナ・セヴェリニ (*Glossina sever  
 ini*), 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 (*Glos  
 sina caliginea*), グロシナ・フスキペス・フスキペス (*Glossin  
 a fuscipes fuscipes*), グロシナ・フスキペス・マルティニイ (*G  
 lossina 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 newstead  
 i*), グロシナ・パルパリス・パルパリス (*Glossina palpalis pa  
 lpalis*), グロシナ・パルパリス・ガンビエンシス (*Glossina palp  
 alis 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 (*C  
 eratopogonidae*) 科のヌカカ (クリコイデス (*Culicoides*) 属 40  
 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 s  
 onorensis*) を含むが限定されない), レプトコノプス (*Leptoco  
 nops*) 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 (*Lept  
 oconops albiventris*) およびレプトコノプス・トルレンス (*Lept  
 oconops torrens*) を含むが限定されない), およびフォルキボミヤ (*F  
 orcipomyia*) 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 dam  
 nosum*), 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 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・ブルイノスム(*Simulium pruinosum*)およびシムリウム・ポスティカトゥム(*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、OL I 0 0 6 8、OL I 0 0 7 1、OL I 0 0 7 2、OL I 0 0 7 4、OL I 0 0 7 8、OL I 0 0 8 0、OL I 0 1 0 0およびOL I 0 1 0 2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(*Bironeilla*)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、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

30

40

50

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 (*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 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 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 c*

olombaschense)、シムリウム・ブルイノスム(Simulium pruinolum)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、OLI00001 ~ OLI00003、OLI00005、OLI00006、OLI00008、OLI00009、OLI00011 ~ OLI00014、OLI00016、OLI00017、OLI00019、OLI00020、OLI00024 ~ OLI00029、OLI00052、OLI00059、OLI00065 ~ OLI00077、OLI00079、OLI00084、OLI00091、OLI00092、OLI00096、OLI00097、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 OLI00001 ~ OLI0102 のうちの少なくとも 1 つを含むデバイス。

20

【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。

【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、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 ( $\text{CO}_2$ ) 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)。 $\text{CO}_2$  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  $\text{CO}_2$  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  $\text{CO}_2$  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)。 $\text{CO}_2$  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  $\text{CO}_2$  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  $\text{CO}_2$  受容体のシグナル伝達を飽和し、それにより、蚊が  $\text{CO}_2$  プルームを追跡できな

50

くし得るので、CO<sub>2</sub>受容体活性の強力かつ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. 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のうちの少なくとも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 (bitting 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、10  
 ビロネルラ(*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・キ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、20  
 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annonニア(*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* 30  
 40  
 50

*fusciplouris*)、グロシナ・フレジリ(*Glossina frezili*)、グロシナ・ハニングトン(*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 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・ダナムスム(*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

10

20

30

40

50

・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、ビロネルラ (*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、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 (*Tripteroides*) 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 (*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*)、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 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 (*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 (*Culicidae*) の1つまたは複数のメンバー (*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 (*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(*Bironeilla*)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、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(*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(*Verallina*)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 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(Leptocnops)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(Leptocnops albiventris)およびレプトコノプス・トルレンス(Leptocnops 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 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(Bironeilla)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 (*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  
 10 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  
 20 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  
 20 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、  
 30 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  
 40 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 seaverini*)、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 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  
 50 ニイ (*Glossina fuscipes martinii*)、グロシナ・バルリケ

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・ブルイノスム (*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、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 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、リマトウス (*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 (*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 (*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、トキシソリンキテス (*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 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 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・メタルリウム (*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 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る。

#### 【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0.2mg/ml~約2mg/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、ダニおよびノミまたはマ

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50ppm～約150ppm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1cm<sup>2</sup>～約5cm<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1.5cm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)、ダシブシルス (Dasyptyllus) 属、ノソプシルス (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 namacqua) 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 (Bironeella) 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、コクイルレトティディア (Coquillettiidia) 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、ジョンベルキニア (*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anno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 (*Urano*  
*taenia*) 属のメンバー、ヴェルラルリナ (*Verrallina*) 属のメンバー、ウィエオミヤ (*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  
 イペス (*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 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 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 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 (*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  
 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  
 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・メタルリウム (*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 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  $\text{CO}_2$  レベルの変化に応答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「マスキ

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
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	ガンマー-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】

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

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

10

20

30

40

50

c p C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、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。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、これらの特徴的なスパイクのためにc p Aニューロンと区別することができる。これは、c p Bおよびc p C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、c p Bおよびc p C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。

【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

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

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

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	チグリニン酸 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（OLIO102）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、木ター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 사용되는場合、「水性」という用語は、水と類似しているか、水を含むか、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、ウシ亜科動物、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。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 6 5 】

## 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、アリアルスルホン酸塩、アルブミン加水分解物、アルキルアリア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

## 【 0 0 6 6 】

## 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

## 【 0 0 6 7 】

## 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

## 【 0 0 6 8 】

## 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、ピペリン、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（モスボール）、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、およびヌーフィルム（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

## 【 0 0 6 9 】

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 - モノミリスチン; 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 - オクテニルブタンジオアート; アミロペクチン、水素 1 - オクタデセニルブタンジオアート; 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; クローブおよびクローブ油; 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; 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; ジミリ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; モノミリ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）；ソーブバーク（soap bark）（キラヤサボニン）；ソーブストーン；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。

10

20

30

40

**【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

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、スバックリング (spackling)、スプリंक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ijing (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

$\text{m}^3$  ( $1 \text{ ft}^3$ ) から約  $283 \text{ m}^3$  (約  $10,000 \text{ ft}^3$ ) の範囲のサイズの大型アリーナ (セミフィールドチャンバ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

#### 【0084】

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 (Ritchie) ら (リッチー (Ritchie), 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 simple non-powered passive trap for the collection of mosquitoes for Arbovirus surveillance)」, ジャーナル・オブ・メディカル・エントモロジー (Journal of Medical Entomology), 2013年、第50(1)巻、p. 185~94) 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

#### 【0085】

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

#### 【0086】

##### 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。

【0089】

パッチ

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、材料の薄片を指す。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に限定されないいくつかの材料のいずれかを含み得る。いくつかのパッチは、耐水性または防水性であるように設計される。

【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。

【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

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。

#### 【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。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  $\pm 10\%$  を表すものと理解される。

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。

#### 【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 c p A ニューロンは主要な  $CO_2$  センサーであるが、c p A ニューロンと同時にその活性が可視化され得る c p B および c p C 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)。

#### 【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) らにより 2003 年に記載され (ドブリツァ (Dobritsa), A. A.

10

20

30

40

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10ml/秒で送達した。CO<sub>2</sub> ガスは、制御されたパルス(2.5ml/秒~6.5ml/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ゥ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(5ml/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细管で構成した。毛细管に、感覚子リンパのリングル溶液(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60 spk/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40~60 spk/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20~40 spk/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



【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-シンナムアルデヒド	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urfural	OLI0001	2,4-ルチジン	110
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0002	2-エチルピラジン	119
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0003	2-メトキシピラジン	113
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0004	2-メチルテトラヒドロフラン-3-オン	124
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0007	ギ酸ブチル	101
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0008	シクロペンタノン	143
OLI0006	5-メチルフurfural	OLI0010	乳酸エチル	159
OLI0006	5-メチルフurfural	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 】

【表 7 - 2】

	テナール			
OLI0013	トランス-2-メチル-2-ブ 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 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 テナール	OLI0004	2-メチルテトラヒドロフラ ン-3-オン	148
OLI0013	トランス-2-メチル-2-ブ 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 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 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 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 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-ヒドロキシヘキサン酸エ 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

10

20

30

40

【表 8 - 2】

OL10022	アセト酢酸エチル	OL10016	2-アセチル-5-メチルフラン	65
OL10022	アセト酢酸エチル	OL10018	2-ペンタノン	62
OL10022	アセト酢酸エチル	OL10020	シンナミルニトリル	63
OL10022	アセト酢酸エチル	OL10021	3-ヒドロキシヘキサン酸エチル	68
OL10022	アセト酢酸エチル	OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	87
OL10022	アセト酢酸エチル	OL10028	フェニルアセトアルデヒド	60
OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	OL10018	2-ペンタノン	70
OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	OL10019	酪酸アリル	73
OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	OL10021	3-ヒドロキシヘキサン酸エチル	75
OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	OL10028	フェニルアセトアルデヒド	69
OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	OL10029	フェニルプロピルアルデヒド	64
OL10100	(E)-ヘキサ-3-エン酸メチル	OL10014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	77
OL10100	(E)-ヘキサ-3-エン酸メチル	OL10016	2-アセチル-5-メチルフラン	77
OL10100	(E)-ヘキサ-3-エン酸メチル	OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	82
OL10098	ギ酸イソアミル	OL10017	2-フリルメチルケトン	83
OL10097	ギ酸ヘキシル	OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	82
OL10097	ギ酸ヘキシル	OL10014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	75
OL10096	ギ酸シス-3-ヘキセニル	OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	72
OL10098	ギ酸イソアミル	OL10014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	69
OL10099	プロピオン酸イソアミル	OL10014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	69
OL10098	ギ酸イソアミル	OL10024	ガンマ-ヘプタラクトン	63
OL10098	ギ酸イソアミル	OL10022	アセト酢酸エチル	63
OL10027	レブリン酸メチル	OL10015	2, 3-ジメチルピラジン	97
OL10027	レブリン酸メチル	OL10029	フェニルプロピルアルデヒド	96
OL10008	シクロペンタノン	OL10063	ギ酸プロピル	92
OL10027	レブリン酸メチル	OL10026	クロトン酸メチル	92
OL10091	ヘプタン酸メチル	OL10025	メタンチオールアセタート	89
OL10018	2-ペンタノン	OL10063	ギ酸プロピル	80
OL10027	レブリン酸メチル	OL10019	酪酸アリル	78
OL10027	レブリン酸メチル	OL10020	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 Actv	OLI0018	2-ペンタノン	Mod Actv	63
OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	OLI0020	シンナミルニトリル	Mod Actv	62
OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	OLI0024	ガンマ-ヘプタラクトン	Mod Actv	71
OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	OLI0100	(E)-ヘキサ-3-エン酸メチル	ベータ Actv	77
OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	OLI0028	フェニルアセトアルデヒド	Mod Actv	67
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	92
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0019	酪酸アリル	Mod Actv	61
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0020	シンナミルニトリル	Mod Actv	62
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0021	3-ヒドロキシヘキサン酸エチル	Mod Actv	65
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0024	ガンマ-ヘプタラクトン	Mod Actv	102
OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	OLI0028	フェニルアセトアルデヒド	Mod Actv	77
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	91
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0015	2, 3-ジメチルピラジン	Mod Actv	78
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0016	2-アセチル-5-メチルフラン	Mod Actv	60
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0020	シンナミルニトリル	Mod Actv	115
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0022	アセト酢酸エチル	Mod Actv	112
OLI0017	2-フリルメチルケトン	Mod Actv	OLI0092	メチルアミルケトン	穏やかな Inh	75
OLI0016	2-アセチル-5-メチルフラン	Mod Actv	OLI0014	2, 3, 5-トリメチルピラジン	Mod Actv	78

10

20

30

40



【表 9 - 2】

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



【表 9 - 3】

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

【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 11 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 11 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 11 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 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 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 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 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 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 ン	OLI0070	2-メトキシ-3-メチルピラジン	100

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 (% Red)
OLI0078	(Z)-ヘプタ-3-エニル アセタート	OLI0102	オイゲノール	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ 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 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 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 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	100
OLI0068	2,3-ジエチルピラジン	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ 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) イソプロピルピ ラジン	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ シピラジン	OLI0078	(Z)-ヘプタ-3-エニル アセタート	98
OLI0072	2-メトキシ-3(5 また は 6) イソプロピルピ ラジン	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ 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) イソプロピルピ ラジン	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ 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 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	93
OLI0074	ペンタン酸フルフリ ル	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ シピラジン	OLI0102	オイゲノール	98
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	97
OLI0100	(E)-ヘキサ-3-エン酸 メチル	OLI0068	2,3-ジエチルピラ ジン	OLI0071	2-エチル-3-メトキシ シピラジン	99
OLI0100	(E)-ヘキサ-3-エン酸 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) イソプロピルピ ラジン	99
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	94

10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

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	100
OLI0100	(E)-ヘキサ-3-エン酸 メチル	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	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、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指し、「C o m p」は成分を指し、「R e d」は低下を指し、「M o d」は中程度を指し、「I n h」は阻害剤を指し、「A c t v」は活性化剤を指す。

【0 1 2 5】

10

20

【表 1 3 - 1】

表 1 3. 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

【 0 1 2 6 】

10

20

30

【表 1 3 - 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

【表 1 3 - 3】

OLI0071	2-エチル -3-メトキシ シピラジン	Mod Inh	OLI0074	ペンタン酸 フルフリル	Mod Inh		X	x	79
OLI0071	2-エチル -3-メトキシ シピラジン	Mod Inh	OLI0075	オクタノン -3	Mod Inh		X	x	69
OLI0071	2-エチル -3-メトキシ シピラジン	Mod Inh	OLI0077	トランス -2-デセナ ール	Mod Inh		X	x	76
OLI0074	ペンタン酸 フルフリル	Mod Inh	OLI0071	2-エチル -3-メトキシ シピラジン	Mod Inh	OLI0072	2-メトキシ 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	Mod Inh	OLI0071	2-エチル -3-メトキシ シピラジン	Mod Inh	OLI0102	オイゲノ ール	穏やか な Inh	98
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	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、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指し、「C o m p」は成分を指し、「R e d」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 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 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	98
OLI0102	オイゲノール	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	98
OLI0102	オイゲノール	OLI0082	アルファ,アルフ ァ-ジメチルフェ ネチルブチラー ト		X	73
OLI0102	オイゲノール	OLI0083	酪酸シス-3-ヘキ セニル		X	72
OLI0102	オイゲノール	OLI0084	シス-5-オクテン - 1-オール		X	77
OLI0102	オイゲノール	OLI0074	ペンタン酸フル フリル		X	72
OLI0102	オイゲノール	OLI0089	ゲラニルアセト 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 ヒド		X	68
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	73
OLI0076	プロピオン酸 フェネチル	OLI0074	ペンタン酸フル フリル		X	57
OLI0076	プロピオン酸 フェネチル	OLI0077	トランス-2- デセナール		X	58
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	56
OLI0093	ローズマリー 油	OLI0084	シス-5-オクテン - 1-オール		X	64
OLI0093	ローズマリー 油	OLI0089	ゲラニルアセト 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

## 【 0 1 3 2 】

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。

## 【 0 1 3 3 】

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。

## 【 0 1 3 4 】

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

## 【 0 1 3 5 】

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 1 5 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、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指し、「C o m p」は成分を指し、「M o d」は中程度を指し、「A c t v」は活性化剤を指す。

20

## 【 0 1 3 6 】

【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

【表 1 5 - 2】

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

10

## 実施例 1 1 . 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 1 6 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

## 【0 1 3 8】

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。

## 【0 1 3 9】

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

## 【0 1 4 0】

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。

## 【0 1 4 1】

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

## 【0 1 4 2】

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、「A c t」は活性を指し、「C m p d」は化合物を指し、「C o m p」は成分を指し、「R e d」は低下を指し、「M o d」

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。

【 0 1 4 3 】

【 表 1 6 - 1 】

表 1 6 . 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

【 0 1 4 4 】

【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

## 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*))

10

20

30

40

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  $30 \times 30 \times 30 \text{ cm}$  ( $12 \times 12 \times 12$  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、 $\text{CO}_2$  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  $\text{CO}_2$  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 ( A e d e s a e g y p t i ) 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。この後、BG - センティネル ( B G - S e n t i n e l ) トラップ ( バイオジェンツ ( B i o g e n t s ) A G 、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 - センティネル ( 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、250 ml / 分の流速のタンクからの  $\text{CO}_2$  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、 $\text{CO}_2$  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、 $\text{CO}_2$  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 ( C o r n i n g L i f e S c i e n c e s ) 、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 °C 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。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、エッ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】

10

20

【表 17 - 1】

表 17. 殺幼虫活性

化合物 番号	化合物	100 ppm にお ける致死率%	0.25%の化合物濃 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 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

【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	バレルアルデヒド	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

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 番号	化合物	0.2 mg/ml による 死亡率%	2 mg/ml による 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-ヒドロキシヘキサン酸エチル	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	ガンマー-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	ガンマーヘプタラクトン		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	ガンマーヘプタラクトン		x	0	100

【 0 1 5 8 】

【表 19 - 2】

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		x	0	70
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		x	10	100
OLI0089	ゲラニルア セトン	OLI0102	オイゲノール		x	0	100
OLI0089	ゲラニルア セトン	OLI0093	ローズマリー 油		x	0	100
OLI0093	ローズマリ ー油	OLI0102	オイゲノール		x	0	100
OLI0093	ローズマリ ー油	OLI0084	シス-5-オクテ ン-1-オール		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0095	ベラトルアル デヒド		x	5	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0080	1-オクタノール		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0083	酪酸シス-3-ヘ キセニル		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0082	アルファ, アル ファ-ジメチル フェネチルブ チラート		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0088	ペンタン酸フ ルフリル		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0084	シス-5-オクテ ン-1-オール		x	0	100
OLI0102	オイゲノール	OLI0078	(Z)-ヘプタ-3- エニルアセタ ート		x	0	100
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		x	0	100
OLI0015	2, 3-ジメチ ルピラジン	OLI0024	ガンマ ヘプタラク トン		x	0	15
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		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

## 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、「R e p」は忌避を指し、「C m p d」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。

10

【 0 1 6 0 】

【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

【表 2 0 - 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
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
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
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
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	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 2 0 - 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 -3-オン		X	37
OL10105	プロピオン酸トランス-シン 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 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 1 8 . 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 . 3 c m ( 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 . 5 c m ( 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、1 0 0 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 1 0 0 m g の化合物を含む ] で処理した。1 0 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 2 1 に示される。表中、「A t t」は誘引を指し、「C m p d」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。

【 0 1 6 3 】

【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%

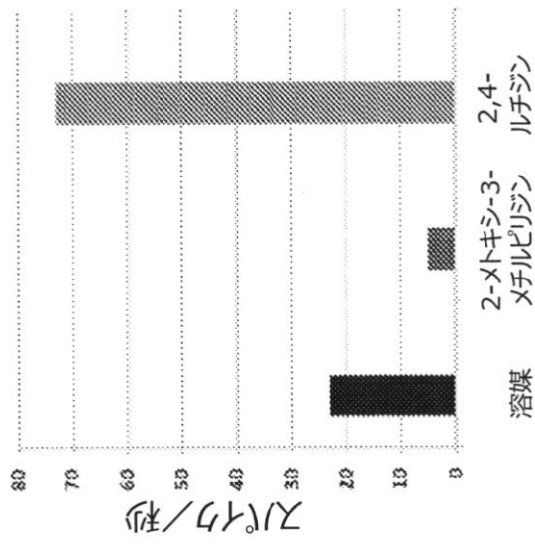
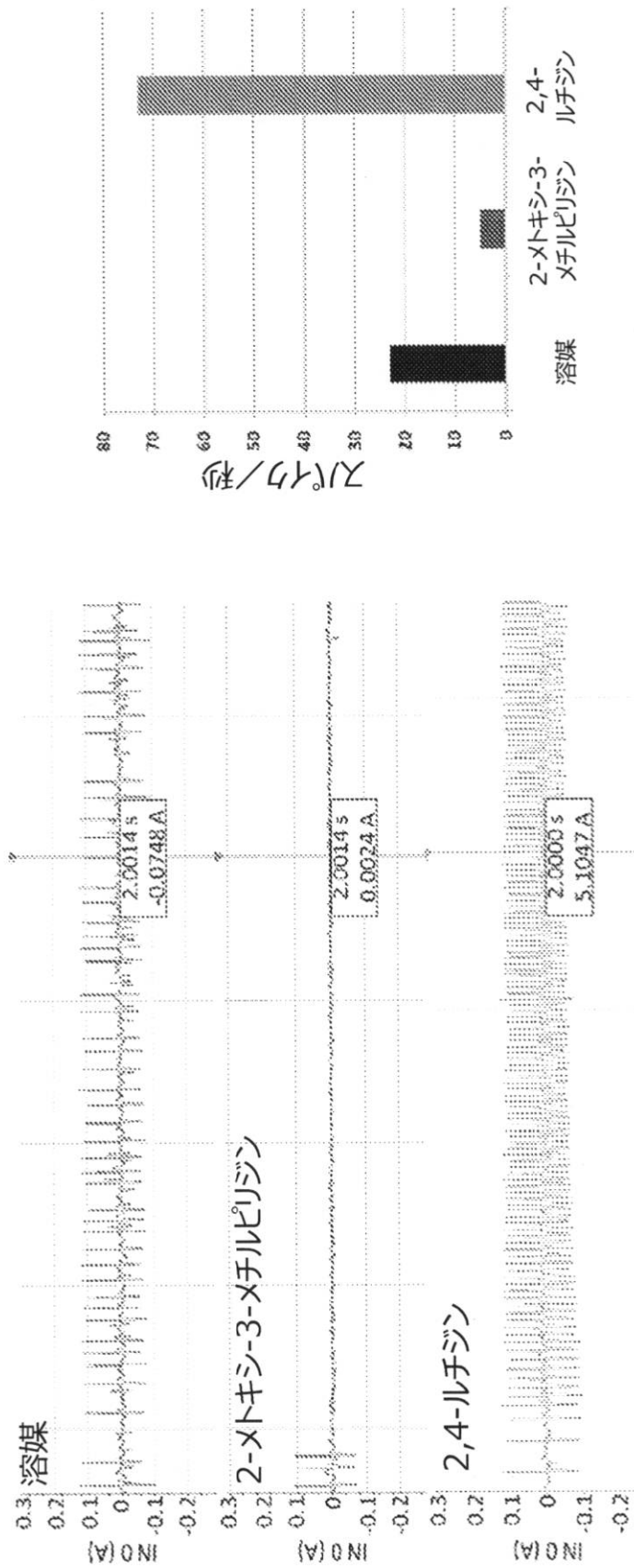
10

20

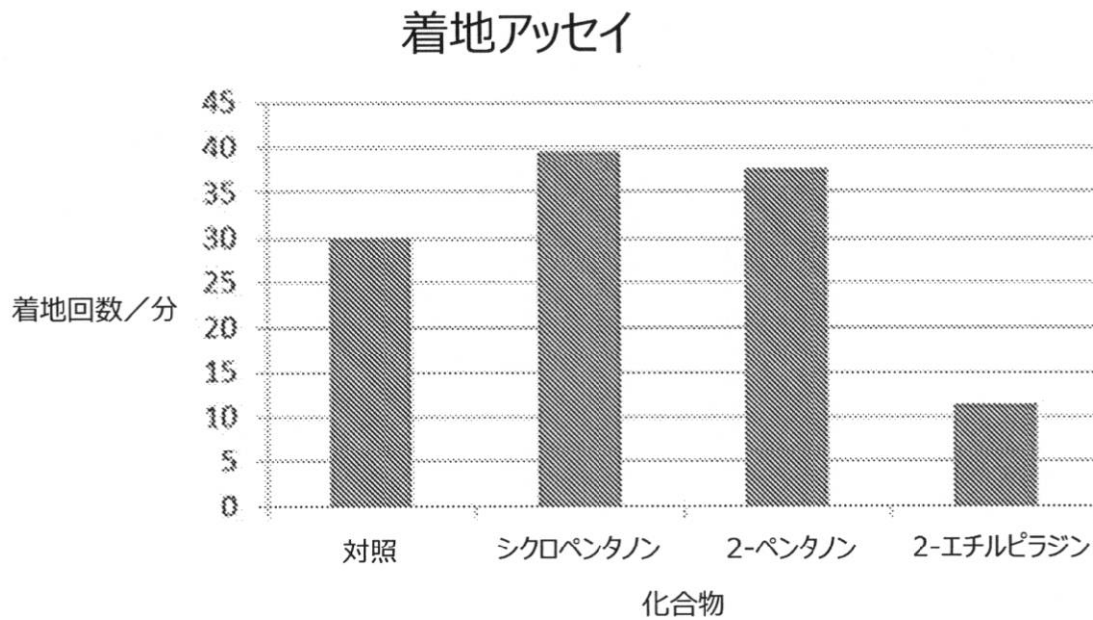
30

40

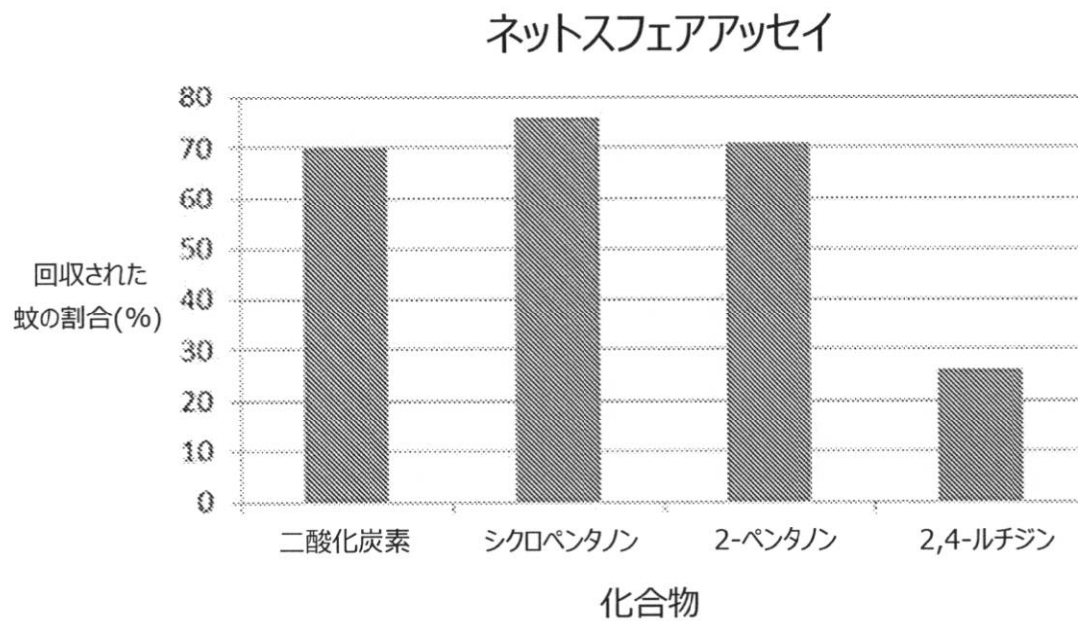
【図 1】



【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つの化合物のうちの少なくとも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、ボリキンダ(Boricinda)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、コクイルレティディヤ(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、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(Mansonnia)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 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 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 pruinatum*) 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、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) OLI00005、OLI00012、OLI00015～OLI00017、OLI0021、OLI00024、OLI00029、OLI00052、OLI00059、OLI00065、OLI00067、OLI00072、OLI00074、OLI00077、OLI00084、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) OLI00014～OLI00017、OLI00020、OLI00024、OLI00029およびOLI0102からなる群から選択されるか、またはOLI00015、OLI00067～OLI00078、OLI00080、OLI00082～OLI00084、OLI00089、OLI00093、OLI00095、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) OLI00017と、OLI00014およびOLI00015のうちから選択される化合物とを含むか、または

(c) OLI00020およびOLI00029を含む、組み合わせか、あるいは

(iii) OLI00007、OLI00008およびOLI00010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OLI00001～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	ペンタン酸フルフルル	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	ペンタン酸フルフルル	ベータ Actv および Mod Inh	OLI0102	オイゲノール	穏やかな Inh		X		72
OLI0074	ペンタン酸フルフルル	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	ペンタン酸フルフルル	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	ペンタン酸フルフルル	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	ペンタン酸フルフルル	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	ペンタン酸フルフルル	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】

【 0 1 5 8 】

【表 19 - 2】

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		x	0	70
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		x	10	100
OLI0089	ゲラニルア セトン	OLI0102	オイゲノール		x	0	100
OLI0089	ゲラニルア セトン	OLI0093	ローズマリー 油		x	0	100
OLI0093	ローズマリ ー油	OLI0102	オイゲノール		x	0	100
OLI0093	ローズマリ ー油	OLI0084	シス-5-オクテ ン-1-オール		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0095	ベラトルアル デヒド		x	5	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0080	1-オクタノー ル		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0083	酪酸シス-3-ヘ キセニル		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0082	アルファ, アル ファ-ジメチル フェネチルブ チラート		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0074	ペンタン酸フ ルフリル		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0084	シス-5-オクテ ン-1-オール		x	0	100
OLI0102	オイゲノー ル	OLI0078	(Z)-ヘプタ-3- エニルアセタ ート		x	0	100
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		x	0	100
OLI0015	2, 3-ジメチ ルピラジン	OLI0024	ガンマ ヘプタラクト ン		x	0	15
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		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（*solo bathroom 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（*solo cup*）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（100 cm × 50 cm または 90 cm × 50 cm）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4 ml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100 mg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 20361000PCT2	<b>FOR FURTHER ACTION</b> see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, item 5 below.	
International application No. PCT/US13/55330	International filing date (day/month/year) 16 August 2013 (16.08.2013)	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 17 August 2012 (17.08.2012)
Applicant 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.

11

International application No.  
PCT/US13/55330

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(8) - A01N 25/00, 43/00 (2014.01) USPC - 504/116.1, 209 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED  Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC(8) - A01N 25/00, 43/00 (2014.01) USPC - 504/116.1, 209  Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched  Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) 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-heptactone, methanethiol acetate		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X — Y        A   Y  Y	 US 2011/0009264 A1 (HACKER, E et al.) 13 January 2011; paragraphs [0027], [0035], [0046], [0150], [0184], [0187]        WO 02/067680 A1 (DELONG, MA et al.) 06 September 2002; abstract; page 6, last paragraph — page 7, first paragraph; table 2; claim 6  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	 1-7, 13, 73 — 65-70, 71/69-71/70, 72/71/69-72/71/70, 74-80 81/73, 81/77, 81/80, 82/81/73, 82/81/77, 82/81/80, 83/81/73, 83/81/77, 83/81/80, 84/83/81/73, 84/83/81/77, 84/83/81/80, 85/84/83/81/73, 85/84/83/81/77, 85/84/83/81/80 — 28-34, 35/31, 35/34, 41, 47-48, 59-61, 63  65-70, 71/69-71/70, 72/71/69-72/71/70  74-80, 81/73, 81/77, 81/80, 82/81/73, 82/81/77, 82/81/80, 83/81/73, 83/81/77, 83/81/80, —***Continued 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	"G" 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	Date of mailing of the international search report	
24 February 2014 (24.02.2014)	18 MAR 2014	
Name and mailing address of the ISA/US	Authorized officer:	
Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450	Shane Thomas	
Facsimile No. 571-273-3201	PCT Helpdesk: 571-272-4300 PCT OSP: 571-272-7774	

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2009)

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.
		<p>***Continued from the Previous Box***  84/83/81/73, 84/83/81/77,  84/83/81/80,  85/84/83/81/73,  85/84/83/81/77,  85/84/83/81/80</p>
Y	US 2004/0124254 A1 (HARADA, S et al.) 01 July 2004; abstract; paragraphs [0001], [0015]	81/73, 81/77, 81/80, 82/81/73, 82/81/77, 82/81/80, 83/81/73, 83/81/77, 83/81/80, 84/83/81/73, 84/83/81/77, 84/83/81/80, 85/84/83/81/73, 85/84/83/81/77, 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, 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, 47-48, 59-61, 63
A	TURNER, SL et al. Ultra-Prolonged Activation of CO2-Sensing Neurons Disorients Mosquitoes. Nature, 02 June 2011, Vol. 474, No. 7349, 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, 47-48, 59-61, 63

PCT/US2013/055330 18.03.2014 5

## 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, guaicol; OLI0018, 2-pentanone; OLI0028, phenylacetaldehyde; OLI0044, ethylformate; OLI0047, ethylevulinate; 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