

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2006-188503

(P2006-188503A)

(43) 公開日 平成18年7月20日(2006.7.20)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
AO 1 N 53/06 (2006.01)	AO 1 N 53/00 5 O 6 Z	4 H O 1 1
AO 1 N 53/08 (2006.01)	AO 1 N 53/00 5 O 8 B	
AO 1 P 17/00 (2006.01)	AO 1 P 17/00	
AO 1 N 25/02 (2006.01)	AO 1 N 25/02	

審査請求 未請求 請求項の数 10 O L (全 10 頁)

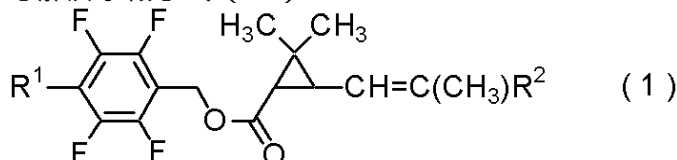
(21) 出願番号	特願2005-354489 (P2005-354489)	(71) 出願人	000002093 住友化学株式会社 東京都中央区新川二丁目27番1号
(22) 出願日	平成17年12月8日 (2005.12.8)	(74) 代理人	100093285 弁理士 久保山 隆
(31) 優先権主張番号	特願2004-358383 (P2004-358383)	(74) 代理人	100113000 弁理士 中山 亨
(32) 優先日	平成16年12月10日 (2004.12.10)	(74) 代理人	100119471 弁理士 榎本 雅之
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)	(72) 発明者	庄野 美徳 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
		Fターム(参考)	4H011 AC06 BA01 BB15 BC01 BC03 BC06 BC19 DA13 DA15 DA17 DA21 DH03

(54) 【発明の名称】 吸血害虫忌避剤

(57) 【要約】

【課題】優れた性能を有する吸血害虫忌避剤を提供すること。

【解決手段】式(1)



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕 10

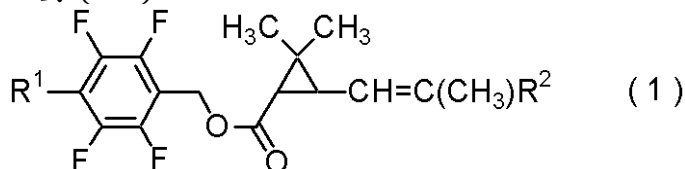
で示されるエステル化合物を有効成分として含有する温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用するための吸血害虫忌避剤は、吸血害虫の忌避に優れた性能を有する。

【選択図】なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(1)



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕

で示されるエステル化合物を有効成分として含有する、温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用するための吸血害虫忌避剤。

10

【請求項 2】

温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材が、温血動物の皮膚である請求項 1 記載の吸血害虫忌避剤。

【請求項 3】

施用が塗布である請求項 1 又は 2 記載の吸血害虫忌避剤。

【請求項 4】

液剤である請求項 1 ~ 3 いずれか一項記載の吸血害虫忌避剤。

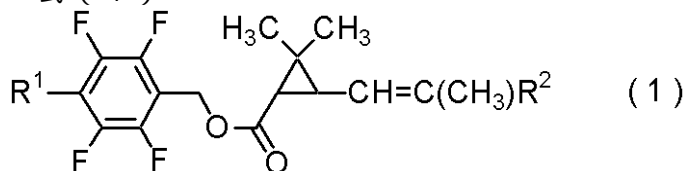
【請求項 5】

吸血害虫が蚊である請求項 1 ~ 4 いずれか一項記載の忌避剤。

20

【請求項 6】

式(1)



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕

で示されるエステル化合物の有効量を、温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用する工程を含んでなる吸血害虫の忌避方法。

30

【請求項 7】

温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材が、温血動物の皮膚である請求項 6 記載の忌避方法。

【請求項 8】

施用が塗布である請求項 6 又は 7 記載の忌避方法。

【請求項 9】

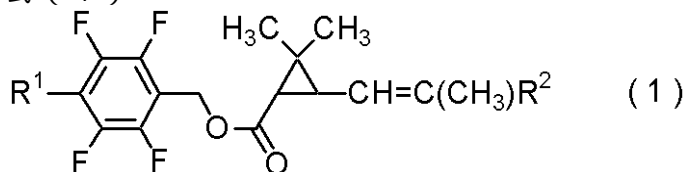
吸血害虫が蚊である請求項 6 ~ 8 いずれか一項記載の忌避方法。

【請求項 10】

温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用するための吸血害虫忌避剤の有効成分としての

40

式(1)



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕

で示されるエステル化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

50

【技術分野】

【0001】

本発明はある種のエステル化合物による、吸血性の蚊、ダニ等の吸血害虫の忌避に関する。

【背景技術】

【0002】

従来、吸血性の蚊、ハエ、ダニ等の吸血害虫による吸血行動から温血動物（ヒト、家畜、ペット等）の身を守ることを目的として吸血害虫に対する忌避効果を有する化合物を有効成分とする忌避剤が用いられている。具体的には蚊に対して忌避活性を有する化合物としてはN, N - ジエチル - m - トルアミド（以下、DEETと記す。）等が知られている（例えば、非特許文献1及び2参照。）。しかしながら、これらは主に温血動物の皮膚に直接塗布して使用されることから、使用量によっては皮膚に対する刺激等が懸念される場合があり、また忌避効果の持続性等の性能面においても必ずしも満足できるものではなかった。

10

【0003】

【非特許文献1】ジャーナル オブ メディカル エントモロジー、1978年、第14巻、第5号、536 - 541頁（J. Med. Entomology, Vol. 14, no. 5: 536 - 541）。

【0004】

【非特許文献2】ジャーナル オブ アメリカン モスキート コントロール アソシエーション、1985年、第1巻、第1号、98 - 100頁（J. Am. Mosq. Control. Assoc., 1985, Vol. 1, No. 1, 98 - 100）。

20

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明は優れた性能を有する吸血害虫忌避剤を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

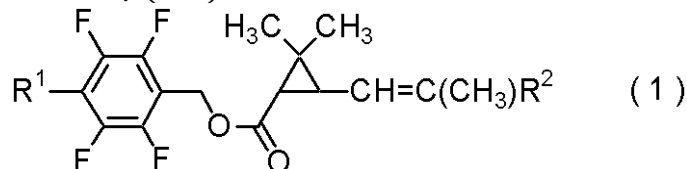
【0006】

本発明者は優れた性能を有する吸血害虫忌避剤を見出すべく鋭意検討した結果、下記式（1）で示されるエステル化合物を有効成分として含有する吸血害虫忌避剤が吸血性の蚊、ダニ等の吸血害虫に対して優れた性能を有することを見出し本発明に到った。

30

すなわち、本発明は次の1. ~ 10. の通りである。

1. 式（1）



〔式中、R¹はメチル基又はメトキシメチル基を表し、R²は水素原子又はメチル基を表す。〕

で示されるエステル化合物を有効成分として含有する、温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用するための吸血害虫忌避剤。

40

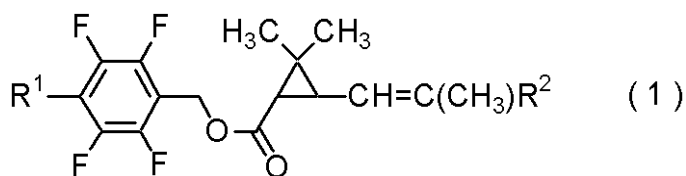
2. 温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材が、温血動物の皮膚である1.記載の吸血害虫忌避剤。

3. 施用が塗布である1.又は2.記載の吸血害虫忌避剤。

4. 液剤である1. ~ 3.いずれか一項記載の吸血害虫忌避剤。

5. 吸血害虫が蚊である1. ~ 4.いずれか一項記載の忌避剤。

6. 式（1）



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕

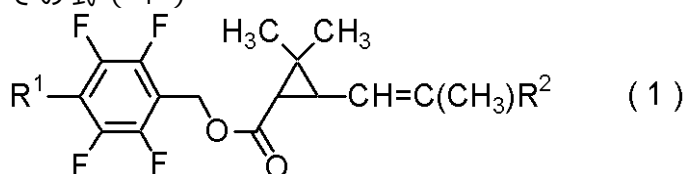
で示されるエステル化合物の有効量を、温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用する工程を含んでなる吸血害虫の忌避方法。

7. 温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材が、温血動物の皮膚である6.記載の忌避方法。

8. 施用が塗布である6.又は7.記載の忌避方法。

9. 吸血害虫が蚊である6.~8.いずれか一項記載の忌避方法。

10 温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用するための吸血害虫忌避剤の有効成分としての式(1)



〔式中、 R^1 はメチル基又はメトキシメチル基を表し、 R^2 は水素原子又はメチル基を表す。〕

で示されるエステル化合物の使用。

【発明の効果】

【0007】

本発明の吸血害虫忌避剤を温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に施用することにより、該温血動物から吸血性の蚊、ダニ等の吸血害虫を忌避することができる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0008】

本発明の吸血害虫忌避剤は式(1)で示されるエステル化合物を有効成分として含有することを特徴の一つとする。

式(1)で示されるエステル化合物は、例えば特開2000-63329号公報又は特開2001-11022号公報に記載された化合物であり、該公報に記載された方法により製造することができる。

式(1)で示されるエステル化合物には不斉炭素に基づく光学異性体が存在し、また炭素-炭素二重結合に基づく幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明においては目的に応じて任意の異性体を単独で、或いは任意の2種以上の異性体の混合物として使用することができる。

【0009】

式(1)で示されるエステル化合物としては例えば以下のものが挙げられる。

式(1)において、 R^1 がメトキシメチル基であるエステル化合物；

式(1)において、 R^1 がメチル基であるエステル化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子であるエステル化合物。

【0010】

式(1)で示されるエステル化合物の具体例としては、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル 3-(1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル 3-(1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル 3-(2-メチル-1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル 1R-トランス-3-(1-プロペニル)-2,2-

10

20

30

40

50

ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル 1R-トランス-3-(1-プロベニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル 1R-トランス-3-(2-メチル-1-プロベニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル 1R-トランス-3-(1-プロベニル(E/Z=1/8))-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート、及び2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル 1R-トランス-3-(1-プロベニル(E/Z=1/8))-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート等が挙げられる。

【0011】

本発明の吸血害虫忌避剤が効力を有する吸血害虫としては吸血性の蚊、ダニ等が挙げられ、具体的には下記のもので挙げられる。

双翅目吸血害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、ネッタシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 等のエーデス (*Aedes*) 類、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス類、ブユ類、アブ類、サシバ工類；

【0012】

隠翅目吸血害虫：ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 等。

シラミ目吸血害虫：アタマジラミ (*Pediculus humanus humanus*)、コロモジラミ (*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*) 等；

【0013】

ダニ目吸血害虫：フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、アメリカンドッグチック (*Dermacentor variabilis*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ixodes scapularis*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、ローンスターチック (*Amblyomma americanum*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ類、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylvarum*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ類、アオツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*) 等のツツガムシ類等。

これらの吸血害虫の中でも、本発明の吸血害虫忌避剤は特に蚊 (イエカ類、エーデス類、アノフェレス類等) に対する忌避効果の点で優れた性能を有する。

【0014】

本発明の吸血害虫忌避剤は、式(1)で示されるエステル化合物そのものでもよいが、通常適当な担体に担持させて、ローション、エアゾール等の液剤、クリームなどの各種形態に調製された製剤として用いられる。これらの製剤には式(1)で示されるエステル化合物が通常0.01~50重量%、好ましくは0.05~20重量%、より好ましくは0.1~5重量%含有される。

【0015】

液剤を調製する際に用いられる液体担体としては、例えばメタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、セチルアルコール、ステアリルアルコール等のアルコール類、灯油、石油ベンジン等、灯油、流動パラフィンの脂肪族炭化水素類、酢酸エチル、ミリスチン酸イソプロピル、モノステアリン酸プロピレングリコール、トリカプリン酸グリセリン等のエステル類、ヒマシ油、オリーブ油、ラノリン、スクワラン、鯨ろう等の動植物油脂類、水及びこれらの混合物が挙げられる。液剤には、液体担体が通常1~95重量%、好ましくは10~90重量%含有される。

液剤には、さらに乳化剤、分散剤、展着剤、湿潤剤、懸濁化剤、保存剤、噴射剤等の製剤用補助剤、塗膜形成剤などを添加することもできる。

10

20

30

40

50

【0016】

乳化剤及び分散剤としては、例えば石鹼類、ポリオキシエチレンオレイルエーテル等のポリオキシエチレン脂肪酸アルコールエーテル、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル等のポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、脂肪酸グリセリド、ポリオキシエチレンソルビタンモノステアレート等のソルビタン脂肪酸エステル、高級アルコールの硫酸エステル、ドデシルベンゼンスルホン酸ソーダ等のアルキルアリアルスルホン酸塩が挙げられ、展着剤及び湿潤剤としては、例えばグリセリン、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、等の多価アルコール類が挙げられる。また、懸濁化剤としては、例えばカゼイン、ゼラチン、アルギン酸、カルボキシメチルセルロース、アラビアガム、ヒドロキシプロピルセルロース、ベントナイトが挙げられ、保存剤としては例えばサリチル酸、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸ブチルが挙げられる。

10

【0017】

噴射剤としては、例えばジメチルエーテル、フルオロカーボン、ブタンガス、炭酸ガス及びLPG（液化石油ガス）が挙げられ、塗膜形成剤としてはニトロセルロース、アセチルセルロース、アセチルブチルセルロース、メチルセルロース等のセルロース誘導体、酢酸ビニル樹脂等のビニル系樹脂、ポリビニルアルコール、メチルポリシロキサン、オクタメチルシクロテトラシロキサン、デカメチルシクロペンタシロキサン、ジメチルポリシロキサン、メチルフェニルポリシロキサンメチルポリシクロポリシロキサン、ジメチルシロキサン・メチル（ポリオキシエチレン）シロキサン共重合体、ジメチルシロキサン・メチル（ポリオキシエチレン・ポリオキシプロピレン）シロキサン共重合体、トリメチルシロキシケイ酸、オクタメチルシクロテトラシロキサンシリコーンポリエーテルポリマー等のシリコーン類が挙げられる。

20

【0018】

クリーム状の形態に調製する際に用いられる担体としては、例えばパラフィン、流動パラフィン、ワセリン等の炭化水素類、ジメチルシロキサン、コロイド状シリカ等のケイ素化合物、ベントナイト等の粘土鉱物、エタノール、ステアリルアルコール、ラウリルアルコール、エチレングリコール、ポリエチレングリコール、グリセリン等のアルコール類、ラウリン酸、ステアリン酸等のカルボン酸類、蜜蝋、ラノリン等のエステル類が挙げられ、さらに、液剤の製剤化の際に用いられるのと同様の製剤用補助剤を添加することもできる。

30

また本発明の吸血害虫忌避剤は、マイクロカプセル化製剤とした後、ローション、エアゾール等に製剤化して用いることもできる。

【0019】

本発明の吸血害虫忌避剤には、さらに他の忌避剤、殺虫剤、酸化防止剤等を添加することができる。他の忌避剤としては例えばDEET、p-メントール-3,8-ジオール、カラン-3,4-ジオール、1-メチルプロピル 2-(2-ヒドロキシエチル)-1-ピペリジンカルボキシラートが挙げられ、殺虫剤としては例えばd-フェノスリン、ペルメトリン、エンペンスリン、トランスフルスリンが挙げられ、酸化防止剤としては例えばブチルヒドロキシアニソール、ジブチルヒドロキシルエーテル、α-オリザノールが挙げられる。

40

【0020】

本発明の吸血害虫忌避剤は、そのまま温血動物（例えばウシ、ブタ、ニワトリ、ヒツジ、ヤギ等の家畜、イヌ、ネコ等のペット、及びヒトが挙げられる）の皮膚に直接施用することにより用いられる。また、本発明の吸血害虫忌避剤は温血動物の皮膚を被覆する基材（以下、被覆材と記す。）に予め施用する、又は温血動物の皮膚を被覆した被覆材に対して被覆後に施用することもできる。かかる被覆材の材質としては、例えばポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン、ポリエステル、ビニロン、ナイロン等の合成繊維や樹脂、絹、綿、羊毛等の動物性繊維又はその混合物が挙げられ、形状としてはシート状、フィルム状、網目状、帯状、衣服状、袋状等が挙げられる。被覆材に予め施用する場合

50

の施用方法としては例えば、塗布、含浸、混練等が挙げられる。また皮膚を被覆した被覆材に対して被覆後に施用する場合の施用方法としては例えば、塗布等が挙げられ、具体的には温血動物が身に付けた衣服等に、例えばポンプスプレー、エアゾール等により噴霧塗布する方法が挙げられる。

【0021】

本発明の吸血害虫の忌避方法は、通常本発明の吸血害虫忌避剤を温血動物の皮膚又は皮膚の被覆材に、塗布、滴下、吹き付け等により施用することによって行われる。その場合、本発明の吸血害虫忌避剤の有効成分である式(1)で示されるエステル化合物の施用量は、吸血害虫を忌避しようとする温血動物の皮膚表面積 1 cm^2 当たり、通常 $0.001 \text{ mg} \sim 0.5 \text{ mg}$ 、好ましくは $0.005 \sim 0.1 \text{ mg}$ である。勿論、該施用量は製剤形態や施用方法、対象とする吸血害虫の種類や密度等により異なり、適宜上記の範囲に関わることなく増加又は減少させることができる。

10

【実施例】

【0022】

以下、製剤例及び試験例を挙げて本発明をより具体的に説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

まず、製剤例を示す。以下の製剤例において、部は重量部を示す。

【0023】

製剤例 1

2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート 0.5 部をエタノールに溶解して全体を 35 部とし、エアゾール容器に充填する。次いで該エアゾール容器をバルブに取り付けた後、該バルブを通じて LPG (噴射剤) 65 部を加圧充填して 2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのエアゾール (本製剤 1) を得る。

20

【0024】

製剤例 2

2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートをを用いて製剤例 1 と同様の操作を行うことにより、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのエアゾール (本製剤 2) を得る。

30

【0025】

製剤例 3

2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートをを用いて製剤例 1 と同様の操作を行うことにより、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのエアゾール (本製剤 3) を得る。

40

【0026】

製剤例 4

2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E/Z = 1/8)) - 2, 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシ

50

レート5部に、ステアリン酸12部、セチルアルコール3部、ラノリン1部、流動パラフィン2部及び水62部を加えて、さらにこれに加熱したグリセリン15部を注入してよく攪拌することにより、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのクリーム(本製剤4)を得る。

【0027】

製剤例5

2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートをを用いて製剤例4と同様の操作を行うことにより、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのクリーム(本製剤5)を得る。

10

【0028】

製剤例6

2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(2-メチル-1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートをを用いて製剤例4と同様の操作を行うことにより、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(2-メチル-1-プロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのクリーム(本製剤6)を得る。

20

【0029】

製剤例7

ステアリン酸6部、ラノリン0.5部及びTween60(ICIアメリカ社製ポリオキシエチレンソルビタンモノステアレート)6部の混合物を80に加熱し、これを60に加熱された水83部とサリチル酸2.5部との混合物に加え、攪拌しながら、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート2部を添加して、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのローション(本製剤7)を得る。

30

【0030】

製剤例8

2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートをを用いて製剤例7と同様の操作を行うことにより、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのローション(本製剤8)を得る。

40

【0031】

製剤例9

2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R-トランス-3-(1-プロペニル(E/Z=1/8))-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートに代えて、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メトキシメチルベンジル1R

50

- トランス - 3 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートを用いて製剤例 7 と同様の操作を行うことにより、2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのローション (本製剤 9) を得る。

【 0 0 3 2 】

次に、本発明が吸血害虫の忌避に有用であることを試験例にて示す。

試験例 1

2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - メトキシメチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E / Z = 1 / 8)) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (以下、供試化合物 1 と記す。) 及び 2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - メチルベンジル 1 R - トランス - 3 - (1 - プロペニル (E / Z = 1 / 8)) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (以下、供試化合物 2 と記す。) 各々 2 . 2 m g をエタノールに溶解させ、各々の供試化合物の 2 m l エタノール溶液とした。また対照として DEET 2 2 . 2 m g をエタノールに溶解させ、DEET の 2 m l エタノール溶液とした。

一方、孵化後 3 ~ 4 日令のヒヨコ腹部をバリカンで除毛して皮膚 2 . 5 x 4 c m を露出させた上、該露出部以外をテープ (オリーブテープ No. 1 4 1 、株式会社寺岡製作所製) で被覆し、露出部を上向きにしてベニヤ板 (縦 1 5 c m 、横 7 c m 、厚さ 3 m m) に固定し、上記供試化合物及び DEET のエタノール溶液 (以下、試験液と記す。) の 9 0 μ l を該露出部に塗布した。ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*) 雌成虫 5 0 頭を放飼したステンレス製の枠のナイロンゴースケージ (2 1 x 2 1 x 3 0 c m) に試験液を塗布したヒヨコをベニヤ板に露出部を上向きにして固定した状態のまま入れて、1 5 分後に該ケージから取り出した。その後、該ケージを冷凍庫に入れ、ケージ中のネッタイシマカを殺虫してから該ケージを取り出し、ケージ中のネッタイシマカを濾紙上に取り出してから押し潰し、吸血したネッタイシマカの数数を数えた。また同時に試験液を塗布しないヒヨコでも試験を行った。同試験は試験液を塗布してから 1 5 分後、1 時間後、2 時間後及び 3 時間後に実施した (各 2 反復) 。その結果を [表 1] に示す。

【 0 0 3 3 】

【 表 1 】

	処理薬量 [mg/m ²]	吸血虫数 [頭]			
		1 5 分後	1 時間後	2 時間後	3 時間後
供試化合物 1	1 0 0	0	0	0	1
供試化合物 2	1 0 0	0	0	2	5
DEET	1 0 0 0	0	1 5	3 0	3 5
無処理	—	3 2	2 8	3 5	3 7

【 0 0 3 4 】

当該試験例 1 により本発明の吸血害虫忌避剤は、DEET と比較して継続して優れた忌避効果を有することが示された。

【 0 0 3 5 】

試験例 2

試験例 1 において、供試化合物 1 及び 2 のエタノール溶液の代わりに本製剤 1 及び 2 を各々所定の処理薬量となるようにヒヨコの露出部に吹き付ける以外は全て同様の試験を行うことにより、優れた忌避効果を確認できる。

【 0 0 3 6 】

試験例 3

孵化後 3 ~ 4 日令のヒヨコ腹部をバリカンで除毛して皮膚 2 . 5 x 4 c m を露出させた上、該露出部以外をテープ (オリーブテープ No. 1 4 1 、株式会社寺岡製作所製) で被覆

10

20

30

40

50

し、露出部を上向きにしてベニヤ板（縦15cm、横7cm、厚さ3mm）に固定する。該露出部を3×4.5cmのナイロンゴース（ナイロン薄布）で被覆し、周囲をテープ（オリーブテープNo.141、株式会社寺岡製作所製）で固定する。該ナイロンゴースに本製剤1及び2を各々100mg/m²となるように塗布する。ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）雌成虫50頭を放飼したステンレス製の枠のナイロンゴースケージ（21×21×30cm）に試験液を塗布したヒヨコをベニヤ板に露出部を上向きにして固定した状態のまま入れて、15分後に該ケージから取り出す。その後、該ケージを冷凍庫に入れ、ケージ中のネッタイシマカを殺虫してから該ケージを取り出し、ケージ中のネッタイシマカを濾紙上に取り出してから押し潰し、吸血したネッタイシマカの数进行を数える。また同時に本製剤を塗布しないヒヨコでも試験を行う。同試験は本製剤を塗布してから15分後、1時間後、2時間後及び3時間後に実施する。その結果、本製剤1及び2が優れた吸血害虫忌避効果を有することを確認できる。