

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3963505号
(P3963505)

(45) 発行日 平成19年8月22日(2007.8.22)

(24) 登録日 平成19年6月1日(2007.6.1)

(51) Int. Cl.	F I	
AO 1 N 37/40 (2006.01)	AO 1 N 37/40	
AO 1 N 25/00 (2006.01)	AO 1 N 25/00	1 0 2
AO 1 N 25/30 (2006.01)	AO 1 N 25/30	
AO 1 N 53/08 (2006.01)	AO 1 N 53/00	5 0 8 C
AO 1 P 19/00 (2006.01)	AO 1 P 19/00	
請求項の数 3 (全 16 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願平8-214120	(73) 特許権者	591063187
(22) 出願日	平成8年7月26日(1996.7.26)		バイエル アクチエンゲゼルシャフト
(65) 公開番号	特開平9-40510		Bayer Aktiengesellschaft
(43) 公開日	平成9年2月10日(1997.2.10)		ドイツ連邦共和国 レーフエルクーゼン (番地なし)
審査請求日	平成15年4月30日(2003.4.30)		D-51368 Leverkusen, Germany
(31) 優先権主張番号	19528306.6	(74) 代理人	100060782
(32) 優先日	平成7年8月2日(1995.8.2)		弁理士 小田島 平吉
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)	(72) 発明者	カール・イウシユトウス
			ドイツ51061ケルン・ボルフスカウル2
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺虫剤の忌避性を低くするためのパラ-ヒドロキシフェニル酢酸

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

使用する殺虫剤が示す忌避作用をパラ-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれの塩および/またはこれと他の化学化合物の混合物で低くすることを特徴とするゴキブリを防除するための殺虫剤組成物。

【請求項2】

ゴキブリを防除するための抗忌避作用を示す殺虫剤組成物の製造方法であって、適宜界面活性剤を用いてパラ-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれの塩および/またはこれと他の化学化合物の混合物を助剤および/または増量剤と混合することを特徴とする方法。

【請求項3】

パラ-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれの塩および/またはこれと他の化学化合物の混合物に加えてカルバミン酸エステル、カルボン酸エステル、燐酸エステル、ホスホン酸エステル、またはニトロメチレン、ニトロイミノ、シアノイミノもしくはシアノメチレン誘導体を含有することを特徴とする請求項1記載のゴキブリを防除するための殺虫剤組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、とりわけゴキブリの防除において殺虫剤が示す忌避性を低くする目的でパラ-ヒドロキシフェニル酢酸をこれ自身または他の化学化合物との混合物の状態を用いる新規

な使用、並びにパラ - ヒドロキシフェニル酢酸を含有するゴキブリ防除用組成物およびこのカルボン酸と他の化学化合物の混合物を含有するゴキブリ防除用組成物に関する。

【0002】

ゴキブリの外寄生は家庭および職場における衛生でかなりの問題になっており、多くの場合、ゴキブリを防除する必要がある。しかしながら、ゴキブリの生活様式が理由でこれを防除するのは非常に困難である。ここで特に問題になる点は、数多くの殺虫剤が忌避性を示すことで防除の成功率が低いことにある。

【0003】

M. K. RustおよびD. A. Reiersen (Journal of Economic Entomology, 70 (1) (1977), 34 - 38) は、クロルピリ
10
フォス (chlorpyrifos)、プロポクスル (propoxur)、ジアジノン
(diazinon) およびDri-die 67が示す作用を改良する目的でゴキブリ
の排泄物の抽出液を用いることを記述し、そしてその効果は上記殺虫剤の忌避性を低下せ
せることにあると論じている。

【0004】

A. E. Glaser (International Pest Control 22
(1) (1980), 7 - 8, 21) は、フェニトロチオン (fenitrothion
) で同じ現象を記述している。

【0005】

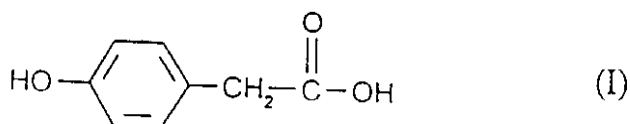
しかしながら、このような方法は商業的使用には不適切である、と言うのは、ゴキブリの
20
排泄物を抽出することで得ることができる抗忌避性 (anti-repellent) 物
質の量は殺虫剤にとって極めて少量に過ぎないからである。

【0006】

驚くべきことに、下記の式 (I)

【0007】

【化1】



30

【0008】

で表される化合物であるパラ - ヒドロキシフェニル酢酸は、それ自身および他の化学化
合物との混合物の両方で、ゴキブリの排泄物の抽出液と同様な様式で殺虫剤の忌避性を低
くし、従ってゴキブリの防除で特に良好に使用できることをここに見出した。

【0009】

本発明に従う抗忌避性 p - ヒドロキシフェニル酢酸 (p = パラ) およびこれと他の化学化
合物の混合物は、殺虫剤、特にピレトロイド類 (pyrethroids) がゴキブリに
対して示す忌避作用を低くし、従って虫防除用化学組成物が示す作用を高める。

【0010】

式 (I) で表される化合物は公知で安定であり、そしてこの化合物は、本発明に従い、こ
れ自身および他の化学化合物との混合物の状態、虫防除用化学組成物、好適には餌およ
びスプレー用途で高い活性を示す。

40

【0011】

式 (I) で表される化合物は酸としてか或は塩の形態で使用可能である。これはまた遊離
酸と個々の塩の混合物としても使用可能である。

【0012】

p - ヒドロキシフェニル酢酸の個々の塩を製造する場合に使用可能な塩基は、活性化化合
物の化学で通常塩基全部、好適にはアルカリ金属、アルカリ土類金属、アンモニウム、ア
ルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、トリアルキルアンモニウムまたはテトラ
50

アルキルアンモニウムの水酸化物、特に好適にはナトリウム、カリウム、カルシウムまたはアンモニウムの水酸化物、特別に好適には水酸化ナトリウムである。

【0013】

ゴキブリ、即ちブラタリアエ (*Blattariae*) 目、特にブラテリダエ (*Blattellidae*) 科、好適にはチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 種の虫、或はゴキブリ科、好適にはプラタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*) およびペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*) 種の虫、そしてまた他の種のゴキブリに対する防除、特に好適にはチャバネゴキブリに対する防除で、式 (I) で表される化合物および/またはこれと他の化学化合物の混合物を本発明に従って用いることができる。

10

【0014】

式 (I) で表される化合物および/またはこれと他の化学化合物の混合物は、本発明に従い、殺虫剤、例えばピレトroid類が示す忌避作用を低くするように、ゴキブリに作用する。

【0015】

このような効果はゴキブリの可動発育段階全部 (幼虫、成虫) で生じる。従って、パラ-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学化合物の混合物は、用いる防除方法の性質に関係なく、ゴキブリの制御で極めて一般的に使用可能である。これは、好適には化学的防除方法で使用可能であり、そして適宜他の活性剤、例えば誘引餌材料または他の誘引物質、合成または天然に存在する殺虫剤などと一緒に使用可能である。

20

【0016】

技術者は、簡単な考慮または簡単な試験を行うことで、個々の意図した使用に好適な混合物、投与形態および量を容易に決定することができるであろう。

【0017】

p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学化合物の混合物を好適には通常のスプレーで投与する。ここでは、通常のアプリケーター (*applicators*) を通常に用いて投与可能な通常の調剤を用いることができる。また、このp-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学化合物の混合物を粉剤または粒剤に調合することも可能であり、適宜これを適切な殺虫剤との混合物の状態に散布してもよい。p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学化合物の混合物の投与量は、好適には m^2 当たり 0.1 から 500 mg、特に好適には m^2 当たり 1 から 200 mg (p-ヒドロキシフェニル酢酸を基準) である。

30

【0018】

殺虫剤を含有する餌の中に入れて用いる場合、p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化合物の混合物を餌材料の中に混合するか、或はそれの近く (例えばその上部) に位置させる。また、p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化合物の混合物を、比較的長期間に渡って放出される形態 (徐放調剤) にしてもよい。これを行うには、例えばこれらを重合体材料、パラフィン、ワックスなどの中に組み込むか、或はマイクロカプセル封じされた形態にしてもよい。トラップとして通常のデバイスを用いることができ、そして食餌を誘引する通常の薬剤を餌材料として用いることができる。p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化合物の混合物を、餌 1 g に対して好適には 0.0001 から 100 mg (特に好適には 0.01 から 20 mg) の量 (p-ヒドロキシフェニル酢酸を基準) で用いる。

40

【0019】

本発明はまたゴキブリ防除用組成物にも関し、これに、適宜通常の担体および助剤および/または他の添加剤 (例えば餌または誘引物質など) に加えて、p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化合物の混合物および少なくとも1種の殺虫活性物質を含有させるが、ここでは、このp-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化合物の混合物を他の成分と混合してもよいか或は個別に配置して存在させることも可能である。

50

【0020】

他の化学化合物は、特に有機カルボン酸、特に好適には安息香酸、フェニル酢酸、アントラニル酸、3-(m-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸、3-(p-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸、2-ヒドロキシプロピオン酸、カプリン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、グルタル酸、アジピン酸、ピメリン酸、スベリン酸、アゼライン酸、メチルピメリン酸、フマル酸またはマレイン酸などを意味する。

【0021】

使用可能な殺虫剤物質はゴキブリに対して活性を示す物質全部である、と言うのは、殺虫作用を示す物質と本発明に従うp-ヒドロキシフェニル酢酸またはその混合物の間では望ましくない相互作用が全く起こらないからである。

10

【0022】

殺虫作用を示す物質は、例えば殺虫作用を示す燐酸エステル、カルバメート類、天然に存在するピレトリン類および合成ピレトロイド類、アミジノヒドラゾン類、スルフラミド類(sulphuramides)、ニトロイミノ、ニトロメチレン、シアノイミノもしくはシアノメチレン化合物、ピロリジン-2,4-ジオン誘導体、ピラゾリン誘導体、アベルメクチン(ivermectin)およびイベルメクチン(ivermectin)誘導体、アザジラクトリン類(azadirachtines)、アンノニン類(annonines)および/またはリアノジン類(ryanodines)に属するものであってもよい。

【0023】

同様に、キチン合成阻害剤(例えばトリフルメロン(triflumeron)、ズフルベンズロン(duflubenzuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)など)そしてまた幼虫ホルモンおよびそれらの疑似物(例えばメトプレン(methoprene)、ヒドロプレン(hydroprene)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)など)または「家庭用薬剤」(ボラックス、酵母菌、ベーキングパウダーなど)を用いることも可能である。

20

【0024】

本発明に従い、p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学品化合物の混合物と一緒に混合するに特に好適な殺虫剤相手として、下記を挙げることができる：

30

1) 式(II)

【0025】

【化2】



【0026】

{ 式中、

R¹は、任意に置換されていてもよい炭素環状もしくは複素環状芳香族基を表すか、或は任意に置換されていてもよいオキシム基を表し、ここで、以下に詳細に示すR¹基が好適であり、

40

R²は、C₁-C₄-アルキルを表し、そして

R³は、水素またはC₁-C₄-アルキルを表すか、或は基Uを表し、ここで、

Uは、基-CO-R⁴

[ここで、

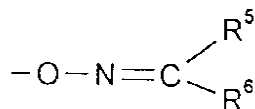
R⁴は、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₃-C₅-アルケノキシ、C₃-C₅-アルキノキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₄-アルキルアミノまたはC₁-C₄-アルキルヒドロキシルアミノを表すか、或は任意にハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、C₁-C₄-アルキル、C₁-

50

C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキレンジオキシ、C₁-C₄-アルキルチオまたはC₁-C₄-アルコキシカルボニルで置換されていてもよいフェノキシ、フェニルチオまたはフェニルアミノを表すか、或は2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチル-7-ベンゾフラニルを表すか、或は式

【0027】

【化3】



10

【0028】

(式中、

R⁵は、水素、C₁-C₄-アルキルまたはジ-C₁-C₄-アルキルアミノカルボニルを表し、そして

R⁶は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ、シアノ-C₁-C₄-アルキルチオまたはC₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキルを表すか、或は2つの基R⁵とR⁶が一緒になって、任意に酸素、硫黄、SOまたはSO₂が割り込んでいてもよいC₂-C₈-アルカンジイルを表す)

で表される基を表す]

を表すか、或は

Uは、基-S_v(O)_w-R⁷

20

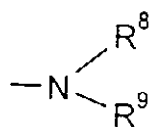
[ここで、

vは、1または2を表し、そして

wは、0、1または2を表すが、各場合ともvが2を表す場合、wは0を表し、R⁷は、任意にハロゲンで置換されていてもよいC₁-C₄-アルキル、C₃-C₅-アルケニル、C₃-C₅-アルキニルまたはC₃-C₆-シクロアルキルを表すか、或は任意にハロゲン、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロチオ、C₁-C₄-アルキルまたはC₁-C₄-アルコキシで置換されていてもよいフェニル、ベンジルまたはフェニルエチルを表すか、或は式

【0029】

【化4】



30

【0030】

(式中、

R⁸は、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₅-アルケニル、C₃-C₅-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキルまたはベンジル表し、そして

R⁹は、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₅-アルケニル、C₃-C₅-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、ベンジル、フェニルエチル、ハロゲノカルボニル、ホルミル、C₁-C₄-アルキルカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシフェノキシカルボニル、C₃-C₅-アルキノキシカルボニル、C₃-C₅-アルケノキシカルボニル、C₁-C₄-アルキルチオカルボニル、C₁-C₄-アルキル-アミノ-カルボニル、C₁-C₄-アルキル-ヒドロキシルアミノカルボニル、C₁-C₁₀-アルキルフェノキシカルボニル、ジ-C₁-C₄-アルキルアミノカルボニル、フェニルチオカルボニル、フェノキシカルボニルまたは2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチル-7-ベンゾフラニルオキシカルボニルを表すか、或は式任意にハロゲン、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、C₁-C₁₀-アルキルまたはC₁-C₄-アルコキシで置換されていてもよいフェニルスルフェニル、フェニルスルフィニル、フェニルスルホニルまたはフェニルを表すか、或は

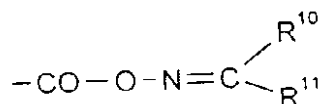
40

50

式

【 0 0 3 1 】

【 化 5 】



【 0 0 3 2 】

で表される基を表し、ここで、

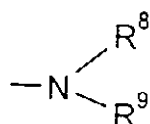
R¹⁰は、上のR⁵で与えた意味を有し、そして

R¹¹は、上のR⁶で与えた意味を有する)

で表される基を表し、そしてここで更に、基

【 0 0 3 3 】

【 化 6 】



【 0 0 3 4 】

において、基R⁸とR⁹が一緒になって、任意に酸素または硫黄が割り込んでいてもよい炭素原子数が3から8の炭化水素鎖を表し、そしてここで更にまた、R⁷は、基S_v(O)_w-R⁷が結合している基と同じ基を表してもよい]

を表す}

で表されるカルバミン酸エステル。

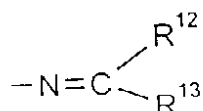
【 0 0 3 5 】

特に好適な活性化合物成分は、

R¹が、任意にC₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシメチル、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルチオメチル、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)-アミノ、ジ-(C₃-C₄-アルケニル)-アミノ、ハロゲン、ジオキソラニル、メチレンジオキおよび/または基-N=CH-N(CH₃)₂で置換されていてもよいフェニル、ナフチル、2,3-ジヒドロ-7-ベンゾフラニル、ピラゾリルまたはピリミジニルから成る群由来の基を表すか、或はR¹が、式

【 0 0 3 6 】

【 化 7 】



【 0 0 3 7 】

[式中、

R¹²およびR¹³は、それぞれ、上のR⁵およびR⁶で与えた意味を有し、

R²は、C₁-C₄-アルキルを表し、そして

R³は、水素またはC₁-C₄-アルキル(好適には水素)を表す]

で表されるアルキリデンアミノ基を表す、

式IIで表されるカルバミン酸エステルである。

【 0 0 3 8 】

式(II)で表されるカルバミン酸エステルの中で挙げることができる例は下記のN-メチルカルバミン酸エステルである: 2-メチル-フェニル、2-エチル-フェニル、2-イソ-プロピル-フェニル、2-s-ブチル-フェニル、2-メトキシ-フェニル、2-

10

20

30

40

50

エトキシ - フェニル、2 - イソ - プロポキシ - フェニル、4 - メチル - フェニル、4 - エチル - フェニル、4 - n - プロピル - フェニル、4 - メトキシ - フェニル、4 - エトキシ - フェニル、4 - n - プロポキシ - フェニル、3, 4, 5 - トリメチル - フェニル、3, 5 - ジメチル - 4 - メチルチオ - フェニル、3 - メチル - 4 - ジメチルアミノフェニル、2 - エチルチオメチル - フェニル、1 - ナフチル、2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチル - 7 - ベンゾフラニル、2, 3 - (ジメチルメチレンジオキシ) - フェニル、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 1 - イル) - フェニル、1 - メチルチオ - エチリデンアミノ、2 - メチルチオ - 2 - メチルプロピリデンアミノ、1 - (2 - シアノ - エチルチオ) - エチリデンアミノおよび 1 - メチルチオメチル - 2, 2 - ジメチルプロピリデンアミノの N - メチルカルバミン酸エステル。2 - イソ - プロポキシ - フェニルの N - メチルカルバミン酸エステルが好適である。

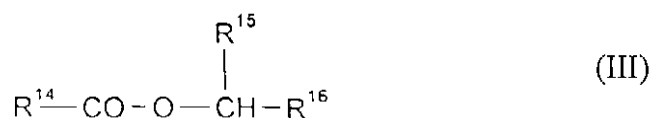
10

【0039】

2) 式 (III)

【0040】

【化8】



【0041】

20

[式中、

R¹⁴ は、任意にハロゲン、アルキル、シクロアルキル、アルケニル (これは任意にハロゲン、アルキルおよび / またはアルコキシで置換されていてもよい)、フェニルまたはスチリル (これらは任意にハロゲンでか、或はアルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシおよび / またはアルキルチオから成る群由来の基 (これは任意にハロゲン置換されていてもよい) で置換されていてもよい)、またはシクロアルキル (アルケニル) (これはスピロ環的に連結しており、任意にハロゲン置換されていてもよく、そして任意にベンゾ縮合していてもよい) で置換されていてもよい開鎖もしくは環状アルキル基を表し、そして更に、

R¹⁵ は、水素、アルキル、ハロゲノアルキル、アルケニル、アルキニルまたはシアノを表し、そして

30

R¹⁶ は、任意に置換されていてもよいアルキルまたはアリール基を表すか、或は複素環基を表すか、或は R¹⁵ およびこの 2 つの基が結合している炭素原子と一緒に、シクロペンタノン環を形成している]

で表されるカルボン酸エステル。

【0042】

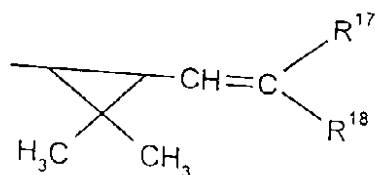
特に好適な活性化合物成分は、

(a) R¹⁴ が、基

【0043】

【化9】

40



【0044】

[ここで、

R¹⁷ は、水素、メチル、フッ素、塩素または臭素を表し、そして

R¹⁸ は、メチル、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₂ - フルオロアルキルまたは C₁ - C₂ - ク

50

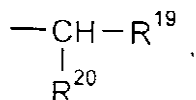
ロロフルオロアルキルを表すか、或は任意に $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオおよび / または $C_1 - C_2$ - アルキレンジオキシから成る群由来の基 (これは任意にハロゲン置換されていてもよい) および / またはハロゲンで置換されていてもよいフェニルを表すか、或は 2 つの基 R^{17} および R^{18} が $C_2 - C_5$ - アルカンジイル (アルキレン) を表す]

を表すか、或は

(b) R^{14} が、基

【0045】

【化10】



10

【0046】

[ここで、

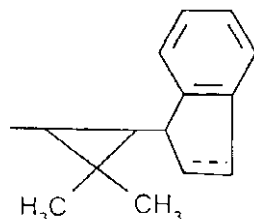
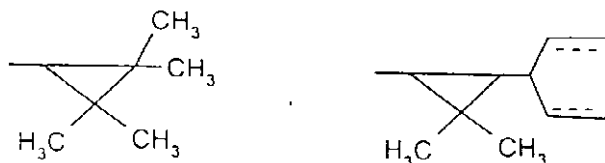
R^{19} は、任意に $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオまたは $C_1 - C_2$ - アルキレンジオキシから成る群由来の基 (これは任意にハロゲン置換されていてもよい) および / またはハロゲンで置換されていてもよいフェニルを表し、そして R^{20} は、イソプロピルまたはシクロプロピルを表す]

を表すか、或は

(c) R^{14} が、メチルまたは基

【0047】

【化11】



20

30

【0048】

[ここで、点線は可能な二重結合を示すことを意図する]

の1つを表す、

式 (III) で表されるカルボン酸エステル、並びに

R^{14} が、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、シアノまたはエチニルを表し、そして

40

R^{16} が、フェニル、フリルおよびテトラヒドロフタルイミドから成る群の基 [ここで、上記基は、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_2 - C_4$ - アルケノキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_2$ - アルキレンジオキシ、フェノキシおよび / またはベンジルから成る群由来の基 (これはハロゲンで置換されていてもよい) および / またはハロゲンで置換されていてもよい] を表し、好適には、 R^{16} が、テトラフルオロフェニル、3,4-ジクロロフェニルまたはテトラヒドロフタルイミドを表すか、或は一方または両方のフェニル環がハロゲン (好適にはフッ素) で置換されていてもよいフェノキシ-フェニルを表す、

式 (III) で表されるカルボン酸エステルである。

50

【 0 0 4 9 】

天然に存在するピレトroid類（例えばピレトラム（pyrethrum）または合成ピレトroid類が、式（ I I I ）で表される更に特に好適なカルボン酸エステルである。

【 0 0 5 0 】

本発明に従う式（ I I I ）で表される特に好適なカルボン酸エステルの中で挙げるができる例は下記のものである：

2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - プロペン - 1 - イル) - シクロプロパン - カルボン酸 3, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - フタルイミド - メチル、 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - シクロプロパン - カルボン酸 3 - フェノキシ - ベンジル、 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - シクロプロパン - カルボン酸 - シアノ - 3 - フェノキシ - ベンジル、 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - シクロプロパン - カルボン酸 - シアノ - 4 - フルオロ - 3 - フェノキシ - ベンジル、 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 2 - ジクロロビニル) - シクロプロパン - カルボン酸 2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - ベンジル、 2, 2 - ジメチル - 3 - (2, 2 - ジブプロモビニル) - シクロプロパン - カルボン酸 - シアノ - 3 - フェノキシ - ベンジルおよび 3 - メチル - 2 - (4 - クロロフェニル) - 酪酸 - シアノ - 3 - フェノキシ - ベンジル。

10

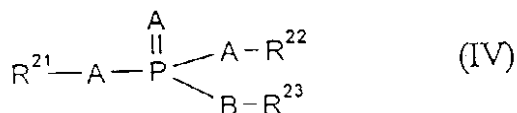
【 0 0 5 1 】

3) 一般式 (I V)

【 0 0 5 2 】

【 化 1 2 】

20



【 0 0 5 3 】

[式中、

A は、同一もしくは異なり、O または S を表し、

B は、O、S または - NH - を表すか、或は中心原子 P と R²³ の間の直接結合を表し、

R²¹ および R²² は、同一もしくは異なり、任意に置換されていてもよいアルキルまたはアリールを表し、そして

R²³ は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルケニルまたはジオキサニルを表すか、或はオキシム基を表すか、或はこれが結合している基と同じ基を表す]

30

で表される燐酸エステルおよびホスホン酸エステル。

【 0 0 5 4 】

式 (I V) で表される特に好適な燐酸エステルおよびホスホン酸エステルは、R²¹ および R²² が、同一もしくは異なり、C₁ - C₄ - アルキルまたはフェニルを表し、

R²³ が、水素を表すか、或は任意にハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、任意にハロゲンで置換されていてもよいフェニル、カルバモイル、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、アルキルカルボニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルコキシカルボニルまたはアルキルアミノカルボニル（後者は各場合とも 6 個以下の炭素原子を有する）で置換されていてもよい 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキルを表す、

40

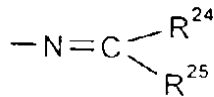
エステル、

更に、R²³ が、任意にハロゲン置換フェニルまたは C₁ - C₄ - アルコキシカルボニルで置換されていてもよい 4 個以下の炭素原子を有するアルケニルを表すか、或は

R²³ が、一般式

【 0 0 5 5 】

【 化 1 3 】



【 0 0 5 6 】

[式中、

R^{24} および R^{25} はそれぞれ上の R^5 および R^6 で与えた意味を有する]

で表される基を表すか、或はシアノまたはフェニルを表す、

エステル、

更に、 R^{23} が、 R^{22} が結合している基と同じ基で置換されているジオキサニルを表すか、

或は R^{23} が、これが結合している基と同じ基を表すか、或は R^{23} が、任意にメチル、ニトロ、

シアノ、ハロゲンおよび / またはメチルチオで置換されていてもよいフェニルを表す

、

エステル、

そして更に特に好適には、

R^{23} が、複素芳香族基、例えばピリジニル、キノリニル、キノキサリニル、ピリミジニルまたはベンゾ - 1, 2, 4 - トリアジニルなど (これらは任意に $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオメチル、 $C_1 - C_4$ - アルキルおよび / またはハロゲンで置換されていてもよい) を表す、

エステルである。

【 0 0 5 7 】

下記のものをも具体的に挙げるができる：

O, O - ジメチル - および O, O - ジエチル - O - (2, 2 - ジクロロ - および 2, 2 - ジブロモビニル) - 燐酸エステル、

O, O - ジエチル - O - (4 - ニトロ - フェニル) - チオノ燐酸エステル、

O, O - ジメチル - O - (3 - メチル - 4 - メチルチオ - フェニル) - チオノ燐酸エステル、

O, O - ジメチル - O - (3 - メチル - 4 - ニトロ - フェニル) - チオノ燐酸エステル、

O - エチル - S - n - プロピル - O - (2, 4 - ジクロロフェニル) - チオノ燐酸エステル、

O - エチル - S - n - プロピル - O - (4 - メチルチオ - フェニル) - チオノ燐酸エステル、

O, O - ジメチル - S - (4 - オキソ - 1, 2, 3 - ベンゾトリアジン - 3 - イル - メチル) - チオノ燐酸エステル、

O - メチル - O - (2 - イソ - プロピル - 6 - メトキシ - ピリミジン - 4 - イル) - チオノメタンホスホン酸エステル、

O, O - ジエチル - O - (2 - イソ - プロピル - 6 - メチル - ピリミジン - 4 - イル) - チオノ燐酸エステル、

O, O - ジエチル - O - (3 - クロロ - 4 - メチル - クマリン - 7 - イル) - チオノ燐酸エステル、

O, O - ジメチル - 2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - ヒドロキシ - エタン - ホスホン酸エステル、

O, O - ジメチル - S - (メチルアミノカルボニル - メチル) - チオノホスホン酸エステル、

O - メチル - O - (6 - メトキシ - 2 - t - ブチル - ピリミジン - 4 - イル) - チオノエタンホスホン酸ジエステル。

【 0 0 5 8 】

4) 式 (V)

【 0 0 5 9 】

【 化 1 4 】

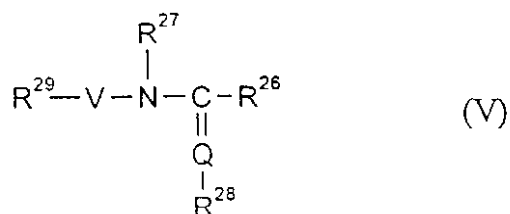
10

20

30

40

50



【0060】

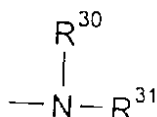
[式中、

R²⁶は、C₁-C₄-アルキル（好適にはメチルまたはエチル）を表すか、或は基

10

【0061】

【化15】



【0062】

(ここで、

R³⁰は、C₁-C₄-アルキル（好適にはメチルまたはエチル）を表す)

を表すか、或は

20

R³⁰とR²⁷が一緒になって任意に分枝していてもよいC₂-C₅-アルカンジイル鎖（好適には-(CH₂)₂-または-(CH₂)₃-)を表し、そしてR³¹は、水素またはC₁-C₄-アルキル（好適には水素）を表し、R²⁷は、C₁-C₄-アルキル（好適にはメチルまたはエチル）を表すか、或はR³⁰と一緒になって任意に分枝していてもよいC₂-C₅-アルカンジイル鎖（好適には-(CH₂)₂--または-(CH₂)₃-)を表し、R²⁸は、NO₂またはCNを表し、R²⁹は、任意に置換されていてもよい（好適にはハロゲンおよび/またはC₁-C₄-アルキルで置換されている）複素芳香族基（好適にはピリジル基）を表し（ここで、R²⁹は特

30

に好適には2-クロロピリジ-5-イル基を表し)、

Qは、=C-または=N-を表し、そして

Vは、直接結合を表すか、或はC₁-C₃-アルカンジイル基（好適には-CH₂-)を表

す]

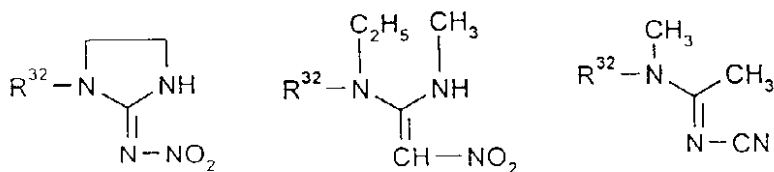
で表されるニトロメチレン、ニトロイミノ、シアノイミノまたはシアノメチレン誘導体。

【0063】

式(V)で表される特に好適な化合物のいくつかを例として以下に具体的に挙げる：

【0064】

【化16】



40

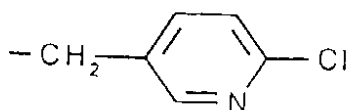
【0065】

ここで、

R³²は、

【0066】

【化17】



【 0 0 6 7 】

基を表す。

【 0 0 6 8 】

この上で述べた基の一般式および定義において、上記基は下記の一般的意味および好適な意味を有する。

【 0 0 6 9 】

アルキルは、そのままとしてか或はアルコキシまたはアルコシカルボニルの構成要素として、炭素原子を1から5個、好適には1から4個、特に好適には1から3個有する直鎖もしくは分枝アルキルを表し、ここでは具体的にメチル、エチル、*n*-および*i*-プロピル、および*n*-、*i*-、*s*-および*t*-ブチルを挙げることができ、ここでは特にメチルおよびエチル、特にメチルを選択すべきである。

【 0 0 7 0 】

任意に置換されていてもよいフェニル、フェノキシまたはフェノシカルボニルにおいて、このフェニル環は、同一もしくは異なってもよい置換基を好適には1から3個、特に好適には1または2個有する。置換基は、活性化化合物の化学に通常の置換基全部であり得る。挙げるのできる好適な置換基は、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロゲンアルコキシ、ニトロ、ヒドロキシおよびハロゲン（好適にはフッ素、塩素および/または臭素）である。

【 0 0 7 1 】

p-ヒドロキシフェニル酢酸および/またはこれと他の化学化合物および/または殺虫剤物質の混合物、および殺虫剤物質と*p*-ヒドロキシフェニル酢酸の混合物および/またはこれと他の化学化合物の混合物は、これの個々の物理的および/または化学的特性に応じて、通常の調剤、例えば液剤、乳剤、懸濁剤、粉剤、フォーム、ペースト、顆粒剤、エロゾル、活性化化合物を含浸させた天然および合成材料、および重合体物質内に活性化化合物が入っている非常に微細なカプセル剤に変換可能である。

【 0 0 7 2 】

公知方法において、例えば本活性化化合物と助剤および/または増量剤、即ち液状溶媒および/または固体状担体を、任意に界面活性剤、即ち乳化剤および/または分散剤および/または発泡剤を用いて一緒に混合することで、上記調剤を製造する。増量剤として水を使用する場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用してもよい。液状溶媒としては、主として次のものが適切である：芳香族類、例えばキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類など、塩化芳香族または塩化脂肪族炭化水素類、例えばクロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレンなど、脂肪族炭化水素類、例えばシクロヘキサンまたはパラフィン類、例えば鉱油留分など、アルコール類、例えばブタノールまたはグリコールなど、並びにそれらのエーテル類およびエステル類、ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンなど、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキサイドなど、並びに水；固体状担体としては、例えば粉碎した天然鉱物、例えばカオリン、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイトまたはケイソウ土など、および粉碎した合成鉱物、例えば高度に分散したシリカ、アルミナおよびケイ酸塩などが適しており、粒剤用の固体状担体としては、例えば破碎し分級した天然石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトなど、並びに無機および有機粉末の合成粒体および有機材料の粒体、例えばのこくず、やし殻、とうもろこしの穂軸およびタバコの茎などが適しており、乳化剤および/または発泡剤としては、例えば非イオンおよび陰イオン乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキル

10

20

30

40

50

アリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、並びにアルブミン加水分解生成物などが適しており；分散剤としては、例えばリグニン - 亜硫酸塩廃液およびメチルセルロースなどが適する。

【 0 0 7 3 】

この調剤では、接着剤、例えばカルボキシメチルセルロース、粉末、粒体またはラテックスの形状の天然および合成重合体、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなどに加えて天然の燐脂質類、例えばセファリン類およびレシチン類など、および合成燐脂質などを使用することができる。他の添加剤は鉱油および植物油であり得る。

【 0 0 7 4 】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルーなど、有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料など、および微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩類などを用いることも可能である。

【 0 0 7 5 】

餌調剤（好適には散在させる餌調剤または固体状餌調剤）の場合、この調剤に、ゴキブリを誘引しそして／またはこれらが該殺虫剤物質を摂取するのを促す他の添加剤を更に含有させてもよい。使用可能な誘引物質および食餌物質は通常に用いられる調合物全部、例えば天然に存在するか或は合成の芳香性物質および／またはゴキブリが容易に摂取する物質、例えば穀類または糖を基とする産物であって澱粉、蛋白質および／または糖を含有する産物などである。

【 0 0 7 6 】

この調剤に p - ヒドロキシフェニル酢酸および／またはこれと他の化学化合物の混合物を好適には 0 . 0 0 1 から 9 5 重量 %、特に 0 . 0 1 から 7 0 重量 % 含有させる。

【 0 0 7 7 】

この調剤に殺虫剤物質を好適には 0 . 1 から 9 5 重量 %、特に 0 . 5 から 9 0 重量 % 含有させる（適宜 p - ヒドロキシフェニル酢酸および／またはこれと他の化学化合物の混合物に加えて）。

【 0 0 7 8 】

使用形態に適切な通常様式で本ゴキブリ防除用組成物を用いる。

【 0 0 7 9 】

p - ヒドロキシフェニル酢酸および／またはこれと他の化学化合物の混合物が示す生物学的活性を以下の実施例で示す。

【 0 0 8 0 】

実施例 A

食餌活動の改良

部屋（2 . 2 5 x 4 . 7 0 m）の向かい合う 2 隅に各場合とも隠れる場所および各場合とも飲物を存在させ、そしてその他の隅に各場合とも 1 片のラスクを置く。ゴキブリ（チャバネゴキブリ（*Blattella germanica*））のオス 2 0 匹およびメス 2 0 匹を放して 1 日後、摂取用の殺虫剤含有餌（殺虫活性を示す化合物：エチルクロルピリフォス（*ethylchlorpyrifos*）が 0 . 5 重量 %）が入っている食餌用缶を各場合とも上記ラスクから 4 0 c m 離れた壁の所に置く。

【 0 0 8 1 】

この餌に p - ヒドロキシフェニル酢酸を含有させるか或は未処理のままにする。

【 0 0 8 2 】

各場合とも、処理した餌が入っている缶が 3 部屋を占めそして未処理の餌が入っている缶が 3 部屋を占める。

【 0 0 8 3 】

この動物のオスおよびメスの死亡率を次の 3 日間測定する。

【 0 0 8 4 】

10

20

30

40

50

試験結果：

処理の種類	死亡率 (%)		
	1日	2日	3日
対照 (殺虫剤のみ)	22	42	52
殺虫剤+10mgの	46	58	63

p-ヒドロキシフェニル酢酸実施例 B

10

実験室試験においてスプレーが示す作用の改良

殺虫活性を示す化合物シフルトリン (cyfluthrin) の投与量が m^2 当たり 20 mg の活性化化合物量になりそして p-ヒドロキシフェニル酢酸の投与量が m^2 当たり 1 mg になるように、(a) シフルトリンを含有するか或は (b) シフルトリンと p-ヒドロキシフェニル酢酸を含有するスプレー用水系液をセラミックタイルに噴霧する。

【0085】

各場合とも飲物、食物、隠れる場所が備わっておりそして 24 時間前にオスおよびメスのチャパネゴキブリ (各 5 匹) を入れておいた容器 (49 x 59 cm、高さ 29.5 cm) の隅に上記タイルの 1 つを置く。各実験を 5 回繰り返す。

【0086】

20

試験結果：

処理の種類	死亡率 (%)	
	1日	2日
対照 (殺虫剤のみ)	32	44
殺虫剤+p-ヒドロキシフェニル酢酸	68	78

実施例 C

30

実用試験でスプレーが示す作用の改良

殺虫活性を示す化合物 - シフルトリンの投与量が m^2 当たり 6.25 mg の活性化化合物量 (推奨量の半分) になりそして p-ヒドロキシフェニル酢酸の投与量が m^2 当たり 1 mg になるように、(a) - シフルトリンを含有するか或は (b) - シフルトリンと p-ヒドロキシフェニル酢酸を含有するスプレー用水系液をオーストラリアで用いた。

【0087】

衛生状態が極めて厄介なアパートで実験を実施した。調剤 (- シフルトリンまたは - シフルトリンと p-ヒドロキシフェニル酢酸) 当たり 7 から 8 ユニットを処理した。接着剤トラップが捕捉する数を処理前および処理して特定時間経った後に評価することにより、活性の測定を行った。

【0088】

40

試験結果：

処理の種類	7日後の減少率
対照 (殺虫剤のみ)	37
殺虫剤+p-ヒドロキシフェニル酢酸	65

本発明の特徴および態様は以下のとおりである。

【0089】

1. 殺虫剤が示す忌避性を低くするためのパラ-ヒドロキシフェニル酢酸の使用。

【0090】

50

2. 殺虫剤が示す忌避性を低くするためのパラ - ヒドロキシフェニル酢酸と他の化学化合物の混合物の使用。

【0091】

3. 使用する殺虫剤が示す忌避作用をパラ - ヒドロキシフェニル酢酸および / またはこれと他の化学化合物の混合物で低くすることを特徴とする殺虫剤組成物。

【0092】

4. 抗忌避作用を示す殺虫剤組成物の製造方法であって、適宜界面活性剤を用いてパラ - ヒドロキシフェニル酢酸および / またはこれと他の化学化合物の混合物を助剤および / または増量剤と混合することを特徴とする方法。

【0093】

5. 殺虫剤が示す忌避性を低くするための p - ヒドロキシフェニル酢酸および / またはこれと他の化学化合物の混合物の使用であって、これの遊離酸または塩類を用いることを特徴とする使用。

【0094】

6. 殺虫剤が示す忌避性を低くするための p - ヒドロキシフェニル酢酸および / またはこれと他の化学化合物の混合物の使用であって、これらを虫および / またはそれらの環境に作用させることを特徴とする使用。

【0095】

7. 活性化合物をゴキブリおよび / またはそれらの環境に作用させることを特徴とする第6項記載の使用。

【0096】

8. ゴキブリを防除するための第3項記載の殺虫剤組成物。

【0097】

9. パラ - ヒドロキシフェニル酢酸および / またはこれの塩類および / またはこれと他の化学化合物の混合物に加えてカルバミン酸エステル、カルボン酸エステル、燐酸エステル、ホスホン酸エステル、またはニトロメチレン、ニトロイミノ、シアノイミノもしくはシアノメチレン誘導体を含有することを特徴とする第3項記載の殺虫剤組成物。

10

20

フロントページの続き

(51) Int.Cl. F I
A 0 1 P 7/04 (2006.01) A 0 1 P 7/04

- (72)発明者 ユルゲン・ゲオルク・レンツ
ドイツ5 1 3 7 3レーフェルクーゼン・アムノイエンホフ1 1
- (72)発明者 ギユンター・ネットビヒ
ドイツ5 1 3 8 1レーフェルクーゼン・インホルツハウゼン2 9 ツエー
- (72)発明者 ユルゲン・シエルケンベク
ドイツ4 2 9 2 9ベルメルスキルヘン・ベフハウゼン7 3
- (72)発明者 マルティン・ダムバツハ
ドイツ5 1 3 9 9ブルシャイト・アルテンヒルゲン7
- (72)発明者 ゲルノート・ベントラー
ドイツ5 0 3 7 4エルフシユタット・ヘディングホーフエナーシユトラーセ4 1

審査官 富永 保

- (56)参考文献 特開平0 6 - 2 1 1 6 0 6 (J P , A)
特開昭5 0 - 0 4 2 0 5 3 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , DB名)

A01N 37/40

A01N 25/00

A01N 53/00