

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5346084号
(P5346084)

(45) 発行日 平成25年11月20日 (2013.11.20)

(24) 登録日 平成25年8月23日 (2013.8.23)

(51) Int. Cl. F 1
AO 1 N 47/40 (2006.01) AO 1 N 47/40 Z
AO 1 P 7/04 (2006.01) AO 1 P 7/04

請求項の数 7 (全 37 頁)

(21) 出願番号	特願2011-525138 (P2011-525138)	(73) 特許権者	501035309
(86) (22) 出願日	平成21年8月25日 (2009.8.25)		ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ
(65) 公表番号	特表2012-501333 (P2012-501333A)		ー
(43) 公表日	平成24年1月19日 (2012.1.19)		アメリカ合衆国 インディアナ州 462
(86) 国際出願番号	PCT/US2009/054876		68, インディアナポリス, ジオンス
(87) 国際公開番号	W02010/027779		ヴィレ ロード, 9330
(87) 国際公開日	平成22年3月11日 (2010.3.11)	(74) 代理人	100092783
審査請求日	平成23年5月13日 (2011.5.13)		弁理士 小林 浩
(31) 優先権主張番号	61/092,077	(74) 代理人	100095360
(32) 優先日	平成20年8月27日 (2008.8.27)		弁理士 片山 英二
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100120134
			弁理士 大森 規雄
		(74) 代理人	100126354
			弁理士 藤田 尚

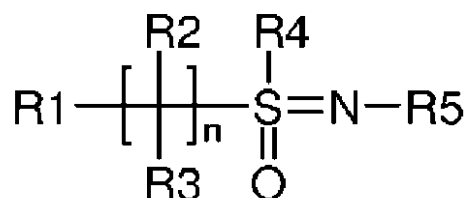
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺虫剤組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の一般式を有する化合物を含む殺虫剤組成物であって、
 【化 1】



(1)

式中、

R 1 は、

(a) 非置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニル、又は

(b) 置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニルであり、各置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニルは、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆

) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁-C₆) アルキル、若しくはヘテロシクリルから独立して選択された1つ又はそれ以上の置換基を有し、

R 2 は、H、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁-C₆) アルキル、又はヘテロシクリルであり、

R 3 は、H、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁-C₆) アルキル、又はヘテロシクリルであり、

場合により、R 2 及び R 3 は、環が O、S、又は N 原子を場合により含有する 3 個以上の環原子を含有する、環を形成することができ、

R 4 は、H、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁-C₆) アルキル、又はヘテロシクリルであり、

場合により、R 4 及び R 2 は結合し、-(CH₂)_n-と共に 4、5、又は 6 員環を形成し、

R 5 は、NO₂、CN、CO₂R₆、非置換ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、C (=O又はS) J (J 1) (J 2) であり、

置換ヘテロシクリルは、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、アリール、アリール (C₁-C₆) アルキル、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁-C₆) アルキル、ヘテロシクリルから独立して選択された1つ又はそれ以上の置換基を有し、

J は、N 又は C (J 3) であり、

J 1、J 2、及び J 3 は、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ、(C₂-C₆) アルケニルチオ、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルチオ、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ、(C₂-C₆) アルキニルチオ、アリール、(C₃-C₆) シクロアルケニル、(C₃-C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆) シクロアルケニルチオ、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₃-C₆) シクロアルコキシ、(C₃-C₆) シクロアルキルチオ、H、ヘテロシクリル、又は (C₀-C₆) アルキル-C(=O)O (J 4) から独立して選択され、これらはそれぞれ、以下の1つ又はそれ以上の置換基、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) ハロアルキル、(C₁-C₆) ハロアルコキシ、ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ、S(=O)_{n1} (C₁-C₆) アルキル (式中、n1=0~2)、S(=O)_{n2} ハロ (C₁-C₆) アルキル (式中、n2=0~2)、OSO₂ ハロ (C₁-C₆) アルキル、C(=O)O (C₁-C₆) アルキル、C(=O) (C₁-C₆) アルキル、C(=O) ハロ (C₁-C₆) アルキル、アリール、ヒドロキシ (C₁-C₆) アルキル、N (J 5) (J 6)、及びヘテロシクリルで独立して置換されていてもよく (Hを除く)、

J 1 及び J 2 は、4、5、又は 6 員環を形成することができ、

J 4、J 5、及び J 6 は、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ

10

20

30

40

50

シ、(C₂ - C₆) アルケニルチオ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ、(C₂ - C₆) アルキニルチオ、アリール、(C₃ - C₆) シクロアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃ - C₆) シクロアルケニルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、H、又はヘテロシクリルから独立して選択され、

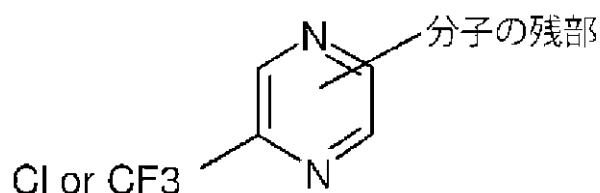
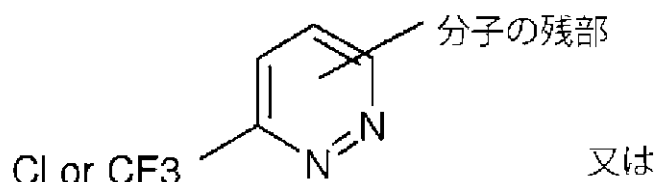
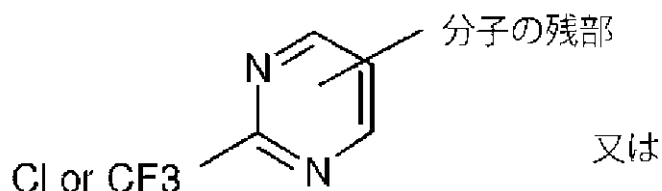
R 6 = (C₁ - C₃) アルキルであり、

n は、0、1、2、又は 3 である 殺虫剤組成物。

【請求項 2】

R 1 が、下式

【化 2】



である、請求項 1 に記載の 殺虫剤組成物。

【請求項 3】

害虫を防除するために、害虫が生息する場所に請求項 1 に記載の 殺虫剤組成物を適用することを含む方法。

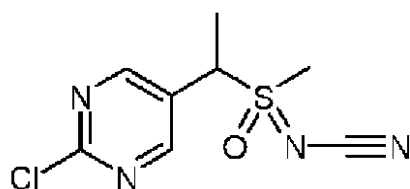
【請求項 4】

害虫を防除するために、害虫が生息する場所に請求項 2 に記載の 殺虫剤組成物を適用することを含む方法。

【請求項 5】

以下の式を有する化合物を含む 殺虫剤組成物。

【化 3】



10

20

30

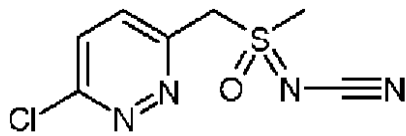
40

50

【請求項 6】

以下の式を有する化合物を含む殺虫剤組成物。

【化 4】

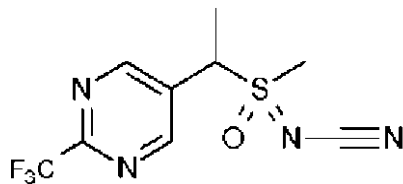


(2)

【請求項 7】

以下の式を有する化合物を含む殺虫剤組成物。

【化 5】



(3)

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、2008年8月27日に出願された米国特許仮出願第61/092077号の利益を主張する。本明細書に開示される本発明は、殺虫剤及び害虫防除におけるそれらの使用の分野に関する。

【背景技術】

【0002】

害虫は、毎年世界中で数百万人のヒトの死をもたらす。さらに、農業に損失をもたらす、一万を超える種の害虫が存在する。これらの農業損失は、毎年数十億米ドルに達する。シロアリは、家などの様々な建造物に被害をもたらす。これらのシロアリ被害の損失は、毎年数十億米ドルに達する。最後に、多くの貯蔵食物の害虫が貯蔵食物を食べ、その品質を落としている。これらの貯蔵食物の損失は毎年数十億米ドルに達するが、さらに重大なのは必要な食物を人々から奪っていることである。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

新規な殺虫剤が深刻に求められている。昆虫は、現在使用されている殺虫剤に耐性を生じつつある。数百の昆虫種が、1つ又はそれ以上の殺虫剤に耐性である。一部の旧来の殺虫剤、例えばDDT、カルバマート剤、及び有機リン剤に対する耐性の発現は周知であるが、一部の新しい殺虫剤に対する耐性も発現している。したがって、新規な殺虫剤、特に新規な作用様式を有する殺虫剤が求められている。

【課題を解決するための手段】

【0004】

置換基（非包括的リスト）

置換基として示す例は（ハロを除いて）非包括的であり、本明細書に開示される本発明を限定するものとして解釈されるべきではない。

【0005】

「アルケニル」は、炭素及び水素からなる非環式不飽和（少なくとも1つの炭素－炭素二重結合）分岐又は非分岐置換基を意味し、例えばビニル、アリル、ブテニル、ペンテニ

10

20

30

40

50

ル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、及びデセニルである。

【0006】

「アルケニルオキシ」は、さらに炭素－酸素単結合からなるアルケニルを意味し、例えばアリルオキシ、ブテニルオキシ、ペンテニルオキシ、ヘキセニルオキシ、ヘプテニルオキシ、オクテニルオキシ、ノネニルオキシ、及びデセニルオキシである。

【0007】

「アルコキシ」は、さらに炭素－酸素単結合からなるアルキルを意味し、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、1－ブトキシ、2－ブトキシ、イソブトキシ、tert－ブトキシ、ペントキシ、2－メチルブトキシ、1, 1－ジメチルプロポキシ、ヘキソキシ、ヘプトキシ、オクトキシ、ノノキシ、及びデコキシである。

10

【0008】

「アルキル」は、炭素及び水素からなる非環式飽和分岐又は非分岐置換基を意味し、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、1－ブチル、2－ブチル、イソブチル、tert－ブチル、ペンチル、2－メチルブチル、1, 1－ジメチルプロピル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、及びデシルである。

【0009】

「アルキニル」は、炭素及び水素からなる非環式不飽和（少なくとも1つの炭素－炭素三重結合、及び任意の二重結合）分岐又は非分岐置換基を意味し、例えばエチニル、プロパルギル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、及びデシニルである。

20

【0010】

「アルキニルオキシ」は、さらに炭素－酸素単結合からなるアルキニルを意味し、例えばペンチニルオキシ、ヘキシニルオキシ、ヘプチニルオキシ、オクチニルオキシ、ノニニルオキシ、及びデシニルオキシである。

【0011】

「アリール」は、水素及び炭素からなる環式芳香族置換基を意味し、例えばフェニル、ナフチル、及びビフェニリルである。

【0012】

「シクロアルケニル」は、炭素及び水素からなる単環式又は多環式不飽和（少なくとも1つの炭素－炭素二重結合）置換基を意味し、例えばシクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、シクロデセニル、ノルボルネニル、ビシクロ〔2. 2. 2〕オクテニル、テトラヒドロナフチル、ヘキサヒドロナフチル、及びオクタヒドロナフチルである。

30

【0013】

「シクロアルケニルオキシ」は、さらに炭素－酸素単結合からなるシクロアルケニルを意味し、例えばシクロブテニルオキシ、シクロペンテニルオキシ、シクロヘキセニルオキシ、シクロヘプテニルオキシ、シクロオクテニルオキシ、シクロデセニルオキシ、ノルボルネニルオキシ、及びビシクロ〔2. 2. 2〕オクテニルオキシである。

【0014】

「シクロアルキル」は、炭素及び水素からなる単環式又は多環式飽和置換基を意味し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロデシル、ノルボルニル、ビシクロ〔2. 2. 2〕オクチル、及びデカヒドロナフチルである。

40

【0015】

「シクロアルコキシ」は、さらに炭素－酸素単結合からなるシクロアルキルを意味し、例えばシクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘプチルオキシ、シクロオクチルオキシ、シクロデシルオキシ、ノルボルニルオキシ、及びビシクロ〔2. 2. 2〕オクチルオキシである。

【0016】

「ハロ」は、フルオロ、クロロ、ブロモ、及びヨードを意味する。

50

【0017】

「ハロアルキル」は、さらに1つから最大可能数の同一であるか又は異なるハロからなるアルキルを意味し、例えばフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロメチル、2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、クロロメチル、トリクロロメチル、及び1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルである。

【0018】

「ヘテロシクリル」は、環構造が少なくとも1つの炭素及び少なくとも1つのヘテロ原子を含有し、前記ヘテロ原子が、窒素、硫黄、又は酸素である、完全飽和、部分不飽和、又は完全不飽和であることのできる環式置換基を意味し、例えばベンゾフラニル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、シンノリニル、フラニル、インダゾリル、インドリル、イミダゾリル、イソインドリル、イソキノリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、オキサゾリニル、オキサゾリル、フタラジニル、ピラジニル、ピラゾリニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、キナゾリニル、キノリニル、キノキサリニル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、チアゾリニル、チアゾリル、チエニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニル、1, 2, 3-トリアゾリル、及び1, 2, 4-トリアゾリルである。

10

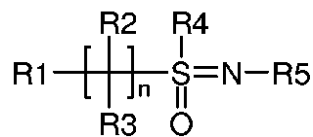
【発明を実施するための形態】

【0019】

本発明の殺虫剤組成物は、以下の一般式を有する分子を含み、

20

【化1】



(1)

式中、

30

R1は、

(a) 非置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニル、又は

(b) 置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニルであり、各置換ピリミジニル、ピリダジニル、若しくはピラジニルは、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルケニルオキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆)シクロアルケニル、(C₃-C₆)シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ、ハロ(C₁-C₆)アルキル、若しくはヘテロシクリルから独立して選択された1つ又はそれ以上の置換基を有し、

R2は、H、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルケニルオキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆)シクロアルケニル、(C₃-C₆)シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ、ハロ(C₁-C₆)アルキル、又はヘテロシクリルであり、

40

R3は、H、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルケニルオキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)アルキニルオキシ、アリール、(C₃-C₆)シクロアルケニル、(C₃-C₆)シクロアルケニルオキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ、ハロ(C₁-C₆)アルキル、又はヘテロシクリルであり、

場合により、R2及びR3は、環がO、S、又はN原子を場合により含有する3個以上

50

の環原子を含有する、環を形成することができ、

R 4は、H、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ、アリール、(C₃ - C₆) シクロアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、又はヘテロシクリルであり、

場合により、R 4及びR 2は結合し、-(CH₂) -と共に4、5、又は6員環を形成し、

R 5は、NO₂、CN、CO₂ R₆、非置換ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、C (= O又はS) J (J 1) (J 2) であり、

10

置換ヘテロシクリルは、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ、アリール、アリール (C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、ヘテロシクリルから独立して選択された1つ又はそれ以上の置換基を有し、

Jは、N又はC (J 3) であり、

J 1、J 2、及びJ 3は、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ、(C₂ - C₆) アルケニルチオ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ、(C₂ - C₆) アルキニルチオ、アリール、(C₃ - C₆) シクロアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃ - C₆) シクロアルケニルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、H、ヘテロシクリル、又は(C₀ - C₆) アルキル-C (= O) O (J 4) から独立して選択され、これらはそれぞれ、以下の1つ又はそれ以上の置換基、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) ハロアルコキシ、ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ、S (= O)_{n1} (C₁ - C₆) アルキル (式中、n₁ = 0 ~ 2)、S (= O)_{n2} ハロ (C₁ - C₆) アルキル (式中、n₂ = 0 ~ 2)、OSO₂ ハロ (C₁ - C₆) アルキル、C (= O) O (C₁ - C₆) アルキル、C (= O) (C₁ - C₆) アルキル、C (= O) ハロ (C₁ - C₆) アルキル、アリール、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル、N (J 5) (J 6)、及びヘテロシクリルで独立して置換されていてもよく (Hを除く)、

20

30

J 1及びJ 2は、4、5、又は6員環を形成することができ、

J 4、J 5、及びJ 6は、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ、(C₂ - C₆) アルケニルチオ、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ、(C₂ - C₆) アルキニルチオ、アリール、(C₃ - C₆) シクロアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルケニルオキシ、(C₃ - C₆) シクロアルケニルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、H、又はヘテロシクリルから独立して選択され、

40

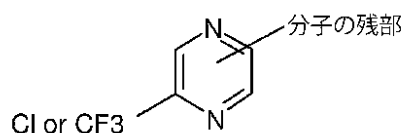
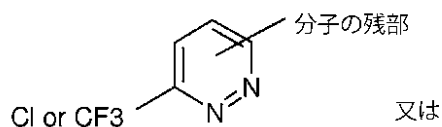
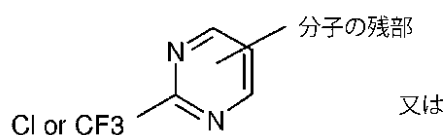
R 6 = (C₁ - C₃) アルキルであり、

nは、0、1、2、又は3である。

【0020】

本発明の別の実施形態において、R 1は、下式である。

【化 2】



【0021】

当分野で公知の手順を用いて、本発明の分子を製造することができる。一般に、これらの分子は以下のとおり製造できる。

【0022】

R⁵ がCNを表し、R¹、R²、R³、R⁴が前に定義されたとおりである式(1a)の化合物は、スキームAに例示した方法によって調製できる。複素環R¹に隣接するメチレン炭素を、N-ブロモスクシンイミド、N-クロロスクシンイミド、又はトリクロロイソシアヌル酸を用いて、最初にハロゲン化する。アルキルチオールナトリウム塩によるハロゲン化物の求核置換によって、スルフィドを調製する。シアナミドの存在下、0℃でスルフィドをヨードベンゼンジアセタートで酸化して、スルフィルイミンを得る。この反応は、ジクロロメタン(CH₂Cl₂)のような極性非プロトン性溶媒中で行うことができる。次いで、スルフィルイミンをm-クロロペルオキシ安息香酸(mCPBA)で酸化する。炭酸カリウムなどの塩基を用いて、mCPBAの酸性度を中和する。プロトン性極性溶媒、例えばエタノール及び水を用いて、スルフィルイミン出発材料及び用いた塩基の溶解度を上げる。スルフィルイミンは、三塩化ルテニウム水和物などの触媒の存在下、過ヨウ素酸ナトリウム又はカリウム水溶液で酸化することもできる。この触媒作用の有機溶媒は、極性非プロトン性溶媒、例えばCH₂Cl₂、クロロホルム、又はアセトニトリルであることができる。

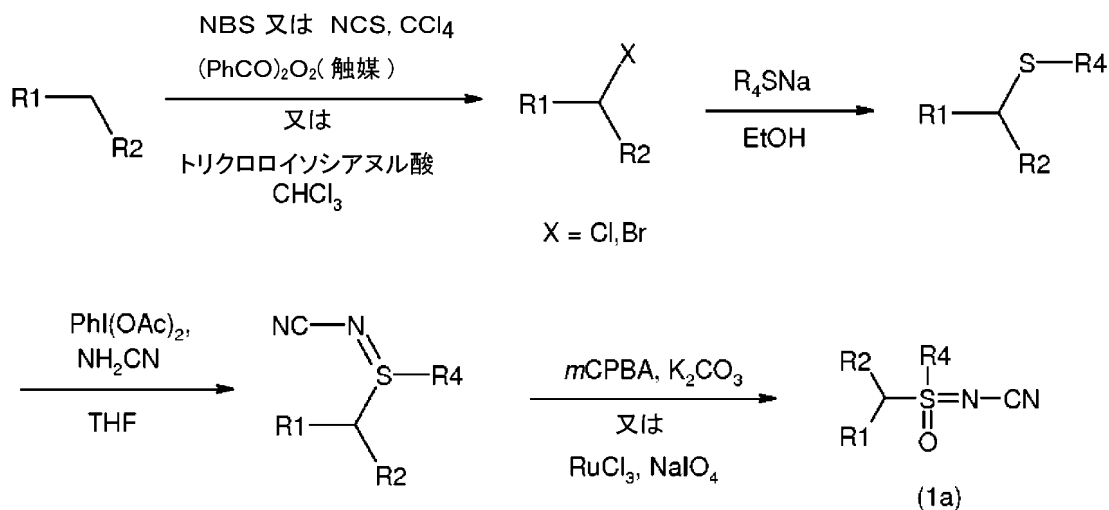
スキームA

10

20

30

【化 3】



10

【0023】

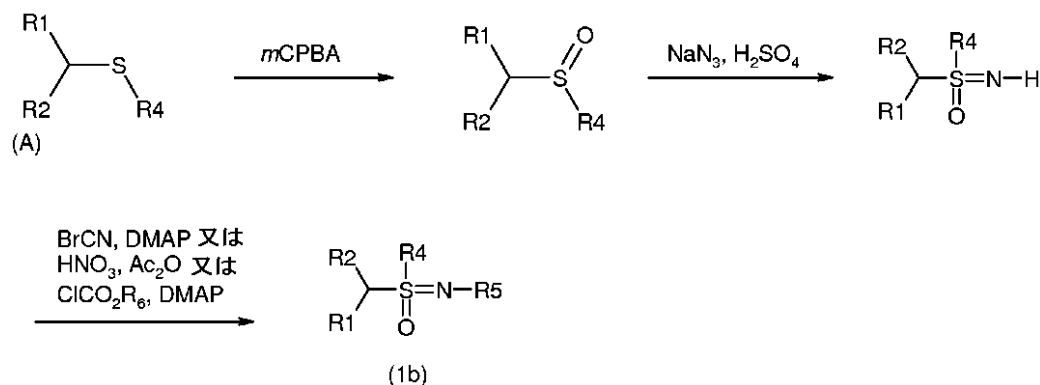
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が前に定義されたとおりであり、 R^5 が CN 、 NO_2 、又は CO_2R^6 である式 (1b) の化合物は、スキーム B に例示した方法によって、スルフィドから調製できる。極性溶媒中、 0°C 未満でスルフィドを $m\text{CPBA}$ で酸化して、スルホキシドを得る。ほとんどの場合、 CH_2Cl_2 が酸化に好ましい溶媒である。次いで、非プロトン性溶媒中、濃硫酸の存在下、加熱しながらスルホキシドをアジ化ナトリウムでイミン化して、スルホキシイミンを得る。ほとんどの場合、クロロホルムがこの反応に好ましい溶媒である。スルホキシイミンの窒素を、塩基の存在下、臭化シアンでシアン化するか、軽度上昇させた温度で無水酢酸の存在下、硝酸でニトロ化するか、又は 4-ジメチルアミノピリジン (DMAP) などの塩基の存在下、クロロギ酸アルキル (R^6) でカルボキシル化して、 N -置換スルホキシイミンを得ることができる。塩基は効率的なシアン化及びカルボキシル化に必要であり、好ましい塩基は DMAP であり、一方、効率的なニトロ化反応のために、触媒として硫酸が用いられる。

20

スキーム B

30

【化 4】



40

【0024】

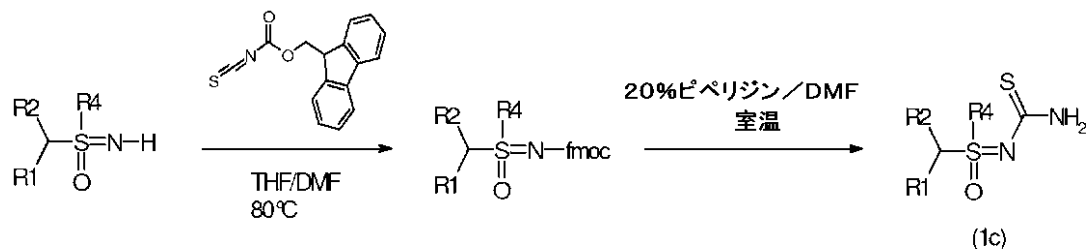
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が前に定義されたとおりであり、 R^5 がチオ尿素 ($-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$) である式 (1c) の化合物は、スキーム C に例示した方法によって、非置換 (N-H) スルホキシイミンから調製できる。スルホキシイミン窒素を、 Fmoc イソチオシアナート ($\text{Fmoc} = 9\text{-フルオレニルメトキシカルボニル}$) と反応させて、 Fmoc 保護チオ尿素を得る。チオ尿素の脱保護は、 N 、 N -ジメチルホルムアミド (DMF) など

50

の溶媒中、ピペリジンなどの塩基で処理することによって達成できる。

スキーム C

【化 5】



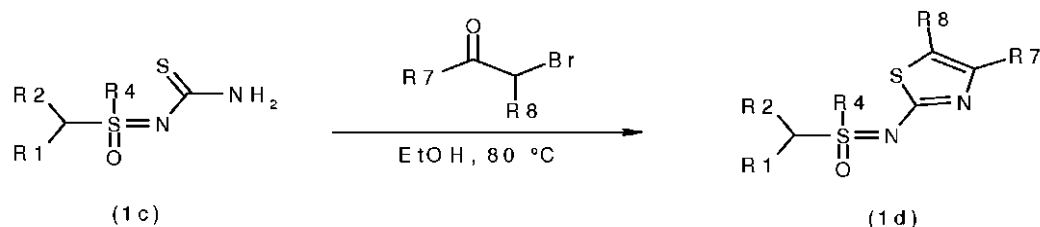
10

【0025】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が前に定義されたとおりであり、 R^5 が置換又は非置換チアゾールである式 (1d) の化合物は、スキーム D に例示した方法によって、チオ尿素置換スルホキシイミン (1c) から調製できる。(1c) と適切に置換した α -ブロモケトン又は α -ブロモアルデヒド (式中、 R^7 及び R^8 は、独立して H、アルキル、ハロアルキル、置換若しくは非置換アリール、又はアリール ($C_1 - C_6$) アルキルである) との反応によって、N-チアゾリルスルホキシイミン (1d) を得る。

スキーム D

【化 6】



20

【0026】

スキーム E に例示したとおり、 R^2 及び $R^3 = H$ であり、 R^1 、 R^4 、及び R^5 が前に定義されたとおりである N-置換スルホキシイミンの α 炭素を、カリウムヘキサメチルジシラジド (KHMDs) などの塩基の存在下、さらにアルキル化又はハロゲン化 (R^2) して、 R^1 、 R^4 、及び R^5 が前に定義されたとおりであり、Z が適切な脱離基である式 (1e) の N-置換スルホキシイミンを得ることができる。好ましい脱離基は、ヨウ化物 ($R^2 = \text{アルキル}$)、ベンゼンスルホンイミド ($R^2 = F$)、テトラクロロエテン ($R^2 = Cl$)、及びテトラフルオロエテン ($R^2 = Br$) である。

スキーム E

【化 7】



40

【0027】

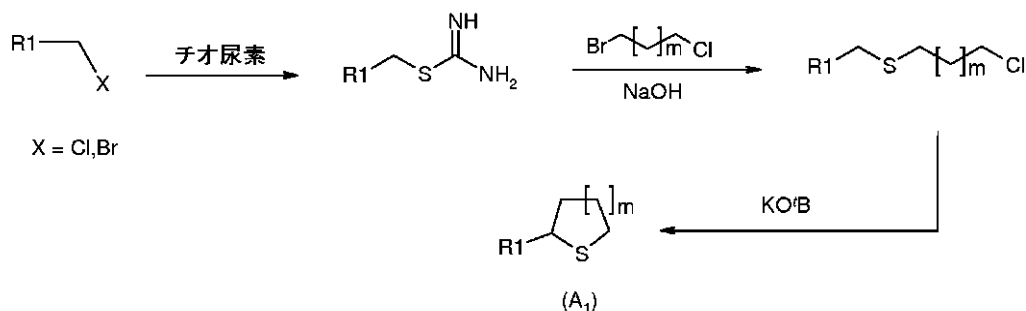
スキーム F では、チオ尿素で処理して、加水分解し、その後、水性塩基条件下、適切なブロモクロロアルカン ($m = 0$ 、1、又は 2) でアルキル化し、テトラヒドロフラン (THF) などの極性非プロトン性溶媒中、カリウム-*t*-ブトキシドのような塩基の存在下

50

、環化することによって、対応する置換クロロメチルヘテロシクリルから、式 (A₁) のスルフィドを調製できる。

スキーム F

【化 8】



10

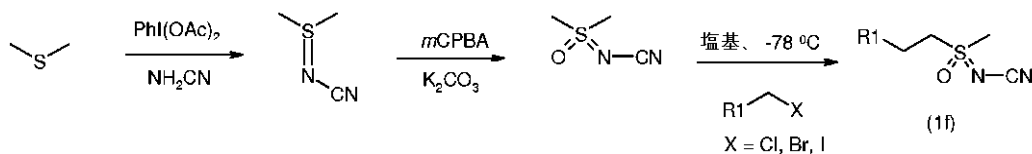
【0028】

n = 2 であり、R² 及び R³ が水素であり、R¹、R⁴、及び R⁵ が前に定義されたとおりである式 (1 f) のスルホキシイミン化合物は、スキーム G に例示した方法によって調製できる。シアナミドの存在下、0℃でジメチルスルフィドをヨードベンゼンジアセートで酸化して、対応するスルフィリイミンを得る。この反応は、CH₂Cl₂ 又は THF のような極性非プロトン性溶媒中で行うことができる。次いで、スルフィリイミンを mCPBA で酸化する。炭酸カリウムなどの塩基を用いて、mCPBA の酸性度を中和する。プロトン性極性溶媒、例えばエタノール及び水を用いて、スルフィリイミン出発材料及び用いた塩基の溶解度を上げる。N-置換スルホキシイミンの α 炭素を、KHMDs 又はブチルリチウム (nBuLi) などの塩基の存在下、ヘテロ芳香族メチルハロゲン化物でアルキル化して、所望の N-置換スルホキシイミンを得ることができる。好ましいハロゲン化物は、臭化物、塩化物、又はヨウ化物であることができる。

20

スキーム G

【化 9】



30

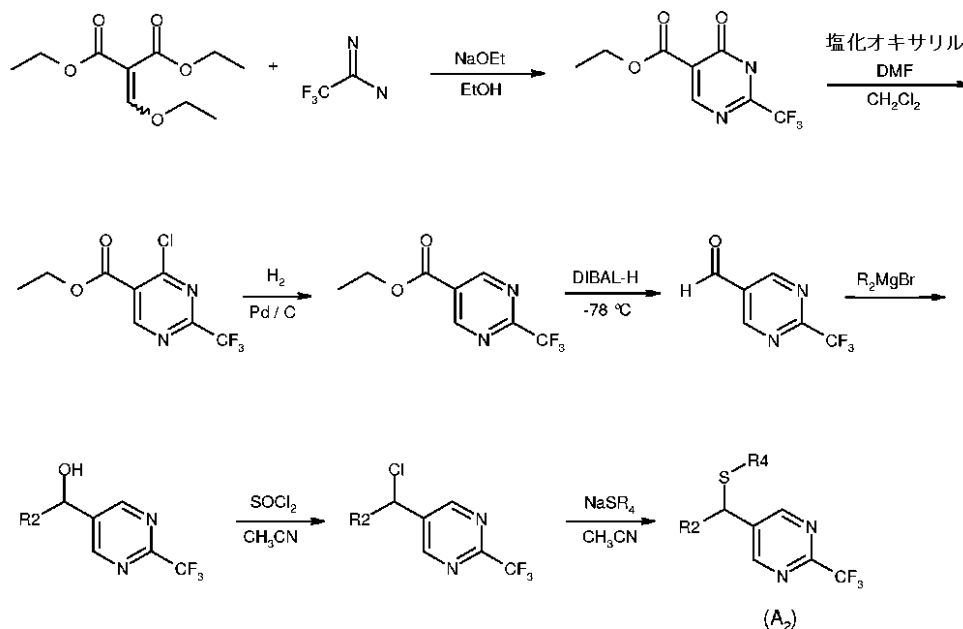
【0029】

式 (A₂) のスルフィド化合物は、スキーム H に例示した方法によって調製できる。2-エトキシメチレン-マロン酸ジエチルエステルを、トリフルオロアセトアミジンと反応させてピリミジンを形成し、次いで、それを塩化オキサリルで塩素化することができる。クロロピリミジンを、水素及びパラジウム炭素触媒を用いて還元して、対応するピリミジンを得ることができる。次いで水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL-H) を用いて、エステルをアルデヒドに還元することができ、その後、それをグリニャール試薬 (R₂MgBr) でアルキル化することができる。得られたアルコールを、塩化チオニルを用いて塩素化することができ、次いで、アルキルチオールのナトリウム塩によるハロゲン化物の求核置換によって、所望のスルフィドを得る。

40

スキーム H

【化 10】



【実施例】

20

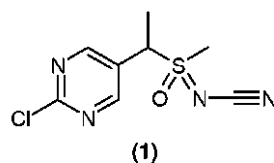
【0030】

これらの実施例は例示を目的とするものであり、本明細書に開示される本発明をこれらの実施例に開示される実施形態のみに限定するものとして解釈されるべきではない。

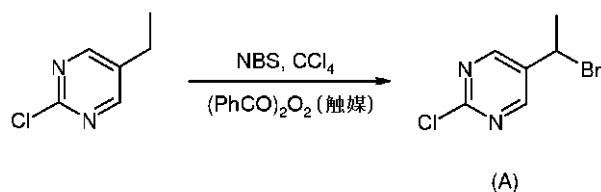
【0031】

実施例 I：[1-(2-クロロピリミジン-5-イル)エチル] (メチル) オキシド-λ⁴-スルファニリデンシアナミド (1) の調製

【化 11】



【化 12】

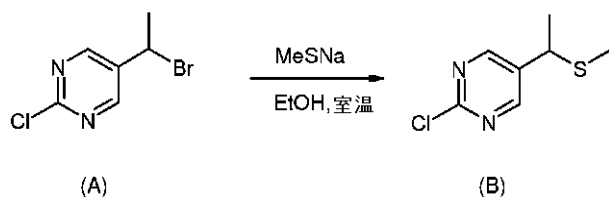


2-クロロ-5-エチルピリミジン (1.15 g、8.1 mmol) の四塩化炭素 20 ml 溶液を、N-ブロモスクシンイミド (1.50 g、8.4 mmol) 及び触媒量 (反応物に対して約 1 モルパーセント) の過酸化ベンゾイルで処理し、その後、75 °C に加熱した。さらに触媒を加え、数時間後、出発材料は完全に消費された。固体を除去し、濾液を濃縮した。得られた残留物をさらに、溶離液として酢酸エチル (EtOAc) と石油エーテルの混合物を用い、シリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィで精製した。溶媒を減圧下で除去して、透明な液体として 0.64 g (36%) の 5-(1-ブロモエチル)-2-クロロピリミジン (A) を得た：¹H NMR (CDCl₃) δ 8.70 (s, 2H), 5.15 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.10 (d, J = 8.0 Hz, 3

50

H) ; GCMS (FID) m/z 222 (M^+)。いくつかの対応するジブロモ化合物 0.44 g (18%) も白色固体として単離された : mp 84~85 °C ; ^1H NMR (CDCl_3) δ 9.00 (s, 2H), 3.00 (s, 3H) ; LC-MS (ESI-MS) m/z 298 (M^+H)。

【化13】



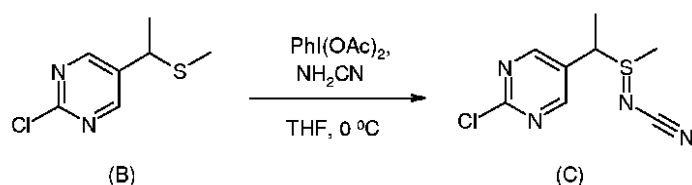
10

【0032】

ナトリウムメチルチオラート (245 mg、3.50 mmol) のエタノール懸濁液を室温で、5-(1-ブロモエチル)-2-クロロピリミジンのエタノール溶液で処理した。5時間後、反応物を CH_2Cl_2 と希塩酸に分配し、飽和塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム (Na_2SO_4) で脱水した。溶媒を減圧下で除去して、淡黄色のシロップとして 0.45 g (89%) の 2-クロロ-5-[1-(メチルチオ)エチル]ピリミジン (B) を得た : ^1H NMR (CDCl_3) δ 8.60 (s, 2H), 3.85 (q, $J=8.0$ Hz, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.65 (d, $J=8.0$ Hz, 3H) ; GC-MS (FID) m/z 188 (M^+)。

20

【化14】



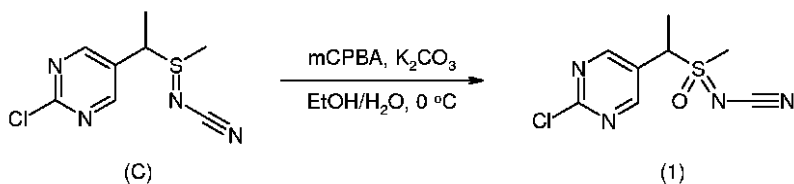
【0033】

2-クロロ-5-[1-(メチルチオ)エチル]ピリミジン (0.49 g、2.61 mmol) 及びシアナミド (120 mg、2.86 mmol) の CH_2Cl_2 20 mL 溶液を 0 °C に冷却し、ヨードベンゼンジアセタート (860 mg、2.59 mmol) で処理した。混合物を 1 時間かけて室温に温め、溶媒を減圧下で除去し、残留物をヘキサンとアセトニトリルに分配した。アセトニトリルを減圧下で除去し、残留物をさらに、溶離液としてアセトンと石油エーテルの 50% 混合物を用い、シリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィで精製した。溶媒を減圧下で除去して、淡いオレンジ色のシロップとして 0.44 g (74%) の (1E)-[1-(2-クロロピリミジン-5-イル)エチル]-(メチル)- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (C) を得た。この物質はジアステレオマーの 2:1 混合物であった。主なジアステレオマーの物理特性は次のとおりであった : ^1H NMR (CDCl_3) δ 8.68 (s, 2H), 4.38 (q, $J=8.3$ Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 1.92 (d, $J=8.3$ Hz, 3H) ; LC-MS (ESI) m/z 229 (M^+H)。

30

40

【化15】



【0034】

水 (H_2O) と CH_2Cl_2 の 1:1 混合物 10 mL 中、過ヨウ素酸ナトリウム (45

50

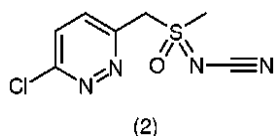
8 mg、2.14 mmol)の迅速に攪拌している混合物を、塩化ルテニウム(III)水和物(13 mg、0.06 mmol)で最初に処理し、次いで(1E)-[1-(2-クロロピリミジン-5-イル)エチル](メチル)- λ^4 -スルファニリデンシアナミド(242 mg、1.06 mmol)の CH_2Cl_2 7 mL溶液を15分間かけて滴加した。混合物を室温で18時間攪拌した。その後、暗色混合物を CH_2Cl_2 と希塩酸に分配し、有機層を Na_2SO_4 で脱水した。溶媒を減圧下で除去し、残留物をアセトンに溶解し、アルミナプラグに通した。アセトンを減圧下で除去して、透明のシロップとして122 mg (50%)の[1-(2-クロロピリミジン-5-イル)エチル](メチル)オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド(1)を得た。この物質はジアステレオマーの2:1混合物であった。主なジアステレオマーの物理特性は次のとおりであった： ^1H NMR (CDCl_3) δ 8.68 (s, 2H), 4.52 (q, $J=9\text{ Hz}$, 1H), 3.10 (s, 3H), 1.95 (d, $J=9\text{ Hz}$, 3H); LC-MS (ESI) m/z 245 (M+H)。

10

【0035】

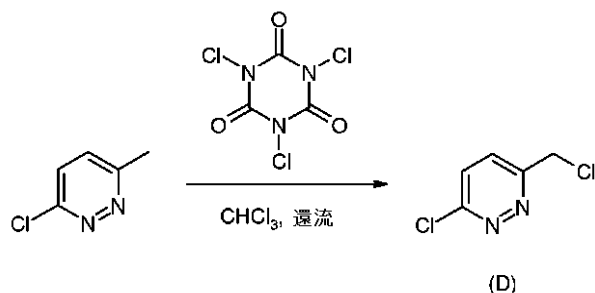
実施例II: [(3-クロロピリダジン-6-イル)メチル](メチル)オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド(2)の調製

【化16】



20

【化17】

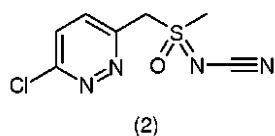


30

クロロホルム(75 mL)中の3-クロロ-6-メチルピリダジン(5.0 g、39 mmol)還流溶液に、トリクロロイソシアヌル酸(3.6 g、16 mmol)を少しずつ添加した。溶液を一晩還流させ、その後、粗反応混合物を濾過し、1 M水酸化ナトリウム(NaOH)で洗浄し、有機相を硫酸マグネシウムで脱水した。粗生成物を減圧下で濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィで精製して、黄色の油として3-クロロ-6-クロロメチルピリダジン(D)を得たが、これは静置により褐色の固体=2.9 g (46%)となった。

【化18】

40



【0036】

実施例Iに示した合成手順を用い、3-クロロ-6-クロロメチルピリダジン(D)から[(3-クロロピリダジン-6-イル)メチル](メチル)オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド(2)を合成した。所望の生成物を黄色の固体として単離した： 1

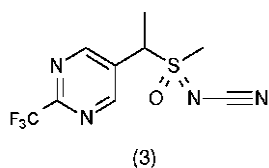
50

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.3 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 7.2 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H) 4.8 (m, 2H), 2.8 (s, 3H); LC-MS (ESI) m/z 230 (M^+).

【0037】

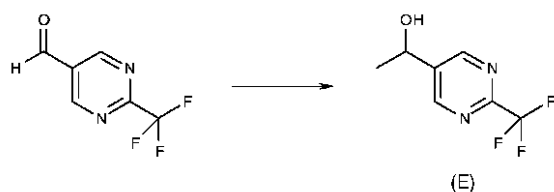
実施例 I I I : メチル (オキシド) {1-[2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-イル]エチル}- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (3) の調製

【化19】



10

【化20】



20

磁気的に攪拌したメチルグリニャール (エーテル (Et_2O) 中 3 M 溶液 19.9 mL、59.7 mmol) の Et_2O (167 mL) 溶液に、 0°C で 2-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルバルデヒド* (9.56 g、54.3 mmol) の Et_2O (50 mL) 溶液を添加し、得られた淡黄色の溶液を室温 (RT) に温め、2.5 時間攪拌した。 0°C で塩化アンモニウム (NH_4Cl) 飽和水溶液 (50 mL) を添加して、反応をクエンチし、混合物を室温に温めた。相を分離し、有機相を Na_2SO_4 で脱水し、濾過し、濃縮して、薄黄色の油を得た (9.32 g 粗製)。この油をフラッシュクロマトグラフィ (330 g SiO_2 、 $0 \rightarrow 100\%$ EtOAc / ヘキサン勾配) で精製して、薄黄色の固体として 1-(2-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)エタノール (E) (8.87 g、85%) を得た： mp $43 \sim 45^\circ\text{C}$; ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.92 (s, 2H), 5.15–5.07 (m, 1H), 2.26 (d, $J=4.0\text{ Hz}$, 1H), 1.62 (d, $J=6.5\text{ Hz}$, 3H); MS (EI) m/z 192 (M^+).

【0038】

* 2-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルバルデヒドは、文献で公知の方法によって4つのステップで調製できる。

【0039】

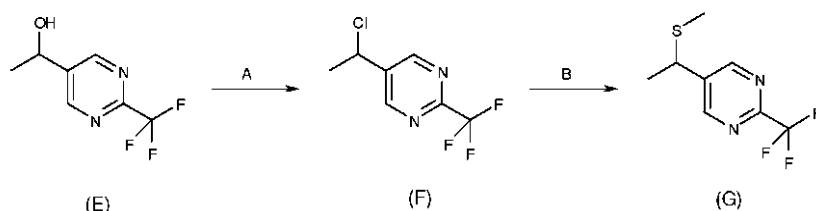
1) Fenwick, A. E.; Hickey, D. M. B.; Ife, R. J.; Leach, C. A.; Pinto, I. L.; Smith, S. A. (SmithKline Beecham PLC, UK). W0200066567, November 9, 2000.

40

【0040】

2) Hickey, D. M. B.; Ife, R. J.; Leach, C. A.; Smith, S. A. (SmithKline Beecham PLC, UK). W0200066566, November 9, 2000.

【化 2 1】



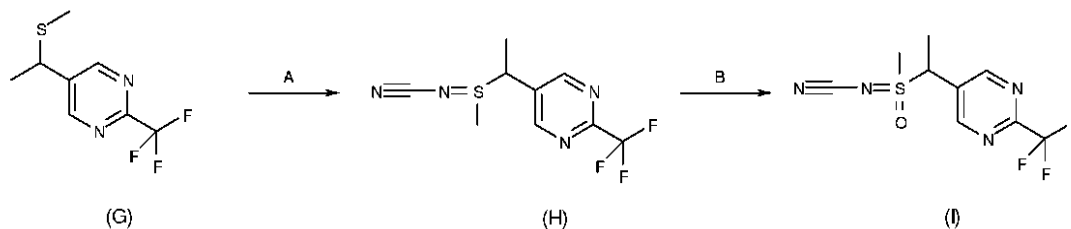
【0041】

A) 磁気的に攪拌した 1-(2-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)エタノール (E; 5.00 g, 26.0 mmol) の無水アセトニトリル (17 mL) 溶液に、0℃で塩化チオニル (3.87 g, 32.5 mmol) を添加した。氷浴を取り除き、得られた薄黄色の溶液を 1 時間攪拌した。反応を GC-MS で分析し、出発材料 (SM) から所望の 5-(1-クロロエチル)-2-トリフルオロメチルピリミジン中間体への完全な転化を確認した ((EI) m/z 210 (M)⁺)。溶媒及び過剰の塩化チオニルをロータリエバポレータで除去し、残留する琥珀色の油を無水アセトニトリル (20 mL) に溶解し、さらに精製することなく用いた。

【0042】

B) 5-(1-クロロエチル)-2-トリフルオロメチルピリミジン (F) の溶液を 0℃に冷却し、ナトリウムチオメトキシド (2.96 g, 42.3 mmol) を 5 分間 (分) かけて少しずつ (3×0.99 g) 添加した。氷浴を取り除き、得られたオレンジ色の混合物を室温に温め、1 時間攪拌した。反応物を塩水 (100 mL) で希釈し、Et₂O (3×150 mL) で抽出した。有機抽出物を合わせ、Na₂SO₄ で脱水し、濾過し、濃縮して、琥珀色の油を得た (5.21 g 粗製)。この油をフラッシュクロマトグラフィ (330 g SiO₂, 0→100% EtOAc/ヘキサン勾配) で精製して、黄色の油として 5-(1-メチルスルホニルエチル)-2-トリフルオロメチルピリミジン (G; 4.16 g, 72%) を得た：¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.86 (s, 2H), 3.92 (q, J=7.3, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.68 (d, J=7.2, 3H); MS (EI) m/z 222 (M)⁺。

【化 2 2】



【0043】

A) 磁気的に攪拌した 5-(1-メチルスルホニルエチル)-2-トリフルオロメチルピリミジン (G; 0.50 g, 2.60 mmol) 及びシアナミド (0.114 g, 2.73 mmol) の無水アセトニトリル (5.2 mL) 溶液に、窒素 (N₂) 下、0℃でヨードベンゼンジアセタート (0.924 g, 2.87 mmol) を添加した。氷浴を取り除き、淡黄色の混合物を室温に温め、得られたオレンジ色の溶液を 16 時間攪拌した。反応を LC-MS で分析して、メチル {1-[2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-イル]エチル}-λ⁴-スルファニリデンシアナミド (H) の形成を確認した ((ESI) m/z 263 [M+H]⁺, 261 [M-H]⁻)。この溶液をヘキサン (5×10 mL) で洗浄し、アセトニトリルをロータリエバポレータで除去して、オレンジ色の油を得て、それを CH₂Cl₂ (26 mL) に溶解し、さらに精製することなく用いた。

【0044】

B) 磁気的に攪拌したメチル {1-[2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-イル]エチル}- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (H; 0.68 g、2.60 mmol) の CH_2Cl_2 (26 mL) 溶液に、過マンガン酸ナトリウム水溶液 (NaMnO_4) (40% 0.92 g、2.60 mmol) を 0°C でゆっくりと添加した。氷浴を取り除き、得られた暗色混合物を室温に温め、1.5 時間攪拌した。反応物を亜硫酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、全混合物を濾過した。相を分離し、水相を CH_2Cl_2 ($2 \times 25\text{ mL}$) で抽出した。有機相を合わせ、塩水 (25 mL) で洗浄し、 Na_2SO_4 で脱水し、濾過し、濃縮して、白色の糊状残留物を得た (0.517 g 粗製)。この粗材料をフラッシュクロマトグラフィ (80 g SiO_2 、 $0 \rightarrow 100\%$ アセトン/ヘキサン勾配) で精製して、無色のロウ状固体としてメチル (オキシド) {1-[2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-イル]エチル}- λ^4 -スルファニリデンシアナミド (I; 0.33 g、46%) のジアステレオマーの 1:1 混合物を得た: ^1H NMR (300 MHz , CDCl_3) δ 9.20 (d, $J=1.3\text{ Hz}$, 2H), 5.40 (q, $J=7.1\text{ Hz}$, 0.5H), 5.38 (q, $J=7.1\text{ Hz}$, 0.5H), 3.54 (s, 1.5H), 3.53 (s, 1.5H), 1.92 (d, $J=7.1\text{ Hz}$, 1.5H), 1.91 (d, $J=7.0\text{ Hz}$, 1.5H); MS (ESI-MS) m/z 279 $[\text{M}+\text{H}]^+$, m/z 277 $[\text{M}-\text{H}]^-$.

10

【0045】

実施例 I V. 殺虫試験

前述の実施例で同定された化合物を、以下に記載の手順を用いて、ワタアブラムシに対して試験した。

20

【0046】

葉面散布アッセイにおけるワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) の殺虫試験

十分に広がった子葉を有するカボチャの苗木を、植物体当たり 1 つの子葉になるように剪定し、化学物質適用の 1 日前にワタアブラムシ (無翅成虫及び若虫) を寄生させた。化学物質適用前に、各植物体を検査して均一な寄生を確保した (植物体当たりアブラムシ約 30~70 匹)。化合物 (2 mg) をアセトン/メタノール (1:1) 溶媒 2 mL に溶解し、1000 ppm のストック溶液を形成した。このストック溶液を、 H_2O 中 0.025% Tween 20 で 5 倍に希釈して、200 ppm の溶液を得た。手持ち式 Devilbiss 吸引型散布器を用いて、カボチャ子葉の両面に流出するまで散布溶液を適用した。各化合物に関して 4 つの植物体 (4 重複試験) を用いた。参照植物体 (溶媒検査) は希釈剤のみを散布した。処理した植物体を、約 23°C 及び相対湿度 (RH) 40% で 3 日間保持室に保持した後、各植物体の生存アブラムシ数を記録した。Abbott の補正式を用いて、殺虫活性を補正防除率%によって測定し、表 1 - 活性に示した。

30

補正防除率% = $100 * (X - Y) / X$

式中、X = 溶媒検査植物体の生存アブラムシ数

Y = 処理植物体の生存アブラムシ数

【0047】

結果を表 1 に示す。

【表 1】

表1－活性

	カボチャのワタアブラムシに対するppm での防除率%(葉面散布)
化合物番号	200 ppm
1	A
2	A
3	A

10

【0048】

表1のそれぞれの場合において、評価尺度は以下のとおりである。

【表 2】

防除率%(又は死亡率)	評価
80-100	A
80未満	B
未検	C

20

【0049】

酸及び塩誘導体、並びに溶媒和物

本発明において開示される化合物は、殺虫剤として許容される酸付加塩の形態であることができる。

30

【0050】

非限定的な例として、アミン官能基は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、酢酸、安息香酸、クエン酸、マロン酸、サリチル酸、リンゴ酸、フマル酸、シュウ酸、コハク酸、酒石酸、乳酸、グルコン酸、アスコルビン酸、マレイン酸、アスパラギン酸、ベンゼンスルホン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ヒドロキシメタンスルホン酸、及びヒドロキシエタンスルホン酸と塩を形成することができる。

【0051】

さらに、非限定的な例として、酸官能基は、アルカリ又はアルカリ土類金属に由来するもの、並びにアンモニア及びアミンに由来するものを含む塩を形成することができる。好ましいカチオンの例としては、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、及びアミニウムカチオンが含まれる。

40

【0052】

塩は、遊離塩基形態を十分な量の所望の酸と接触させて、塩を生成することによって調製される。遊離塩基形態は、塩を適切な希釈塩基水溶液、例えばNaOH、炭酸カリウム、アンモニア、及び炭酸水素ナトリウム希釈水溶液で処理することによって、再生することができる。例として、多くの場合、殺虫剤はより水溶性の形態に改質されており、例えば2, 4-ジクロロフェノキシ酢酸ジメチルアミン塩は、周知の除草剤である2, 4-ジクロロフェノキシ酢酸のより水溶性の形態である。

【0053】

本発明に開示される化合物は、複合体を形成していない溶媒分子を化合物から除去した

50

後も無傷のままである溶媒分子との安定な複合体を形成することもできる。このような複合体は、しばしば「溶媒和物」と称される。

【0054】

立体異性体

本発明に開示されるある種の化合物は、1つ又はそれ以上の立体異性体として存在できる。種々の立体異性体には、幾何異性体、ジアステレオマー、及びエナンチオマーが含まれる。したがって、本発明に開示される化合物には、ラセミ混合物、個々の立体異性体、及び光学活性混合物が含まれる。1つの立体異性体が他の立体異性体より活性であり得ることを当業者は理解するであろう。個々の立体異性体及び光学活性混合物は、選択的合成手順によって、又は分割された出発材料を用いる通常の合成手順によって、又は通常の分割手順によって得ることができる。

10

【0055】

害虫

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、害虫を防除するために用いることができる。

【0056】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、線形動物門の害虫を防除するために用いることができる。

【0057】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、節足動物門の害虫を防除するために用いることができる。

20

【0058】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、鋏角亜門の害虫を防除するために用いることができる。

【0059】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、クモ綱の害虫を防除するために用いることができる。

【0060】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、多足亜門の害虫を防除するために用いることができる。

30

【0061】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、コムカデ綱の害虫を防除するために用いることができる。

【0062】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、六脚亜門の害虫を防除するために用いることができる。

【0063】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、昆虫綱の害虫を防除するために用いることができる。

【0064】

40

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、甲虫目（甲虫）を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Acanthoscelides* spp.（ゾウムシ）、*Acanthoscelides obtectus*（インゲンマメゾウムシ）、*Agrilus planipennis*（アオナガタマムシ）、*Agrilus* spp.（ハリガネムシ）、*Anoplophora glabripennis*（ツヤハダゴマダラカミキリ）、*Anthonomus* spp.（ゾウムシ）、*Anthonomus grandis*（ワタミハナゾウムシ）、*Aphidius* spp.、*Apion* spp.（ゾウムシ）、*Apogonia* spp.（ジムシ）、*Ataenius* spp.（ブラック・ターグラス・アテニウス（Black Turgrass Ataenius））、*Atomari*

50

a linearis (ピグミー・マンゴールド・ビートル (pygmy mangold beetle))
Aulacophore spp.、*Bothynoderes punctiven*
tris (ビート・ルート・ウィービル (beet root weevil))、*Bruchus* sp
 p. (ゾウムシ)、*Bruchus pisorum* (マメゾウムシ)、*Cacoesi*
a spp.、*Callosobruchus maculatus* (ヨツモンマメゾウ
 ムシ)、*Carpophilus hemipteras* (クリヤケシキスイ)、*Cas*
sida vittata、*Cerosterna* spp.、*Cerotoma* sp
 p. (ハムシ)、*Cerotoma trifurcata* (ヒメキバネサルハムシ)、
Ceutorhynchus spp. (ゾウムシ)、*Ceutorhynchus a*
ssimilis (キャベッジ・シードポッド・ウィービル (cabbage seedpod weevil) 10
)、*Ceutorhynchus napi* (キャベツゾウムシ)、*Chaetocne*
ma spp. (ハムシ)、*Colaspis* spp. (土壌甲虫)、*Conoder*
us scalaris、*Conoderus stigmatus*、*Conotrach*
elus nenuphar (スモモゾウムシ)、*Cotinus nitidis* (ア
 オコフキコガネ)、*Crioceris asparagi* (アスパラガスクビナガハ
 ムシ)、*Cryptolestes ferrugineus* (サビカクムネヒラタムシ)
Cryptolestes pusillus (カクムネヒラタムシ)、*Crypt*
olestes turcicus (トルコカクムネヒラタムシ)、*Ctenicera*
spp. (ハリガネムシ)、*Curculio* spp. (ゾウムシ)、*Cycloc*
ephalia spp. (ジムシ)、*Cylindrocpturus adspers* 20
us (サンフラワー・ステム・ウィービル (sunflower stem weevil))、*Depora*
us marginatus (マンゴー・リーフカッティング・ウィービル (mango leaf
 -cutting weevil))、*Dermestes lardarius* (オビカツオブシムシ)
Dermestes maculatus (ハラジロカツオブシムシ)、*Diabr*
otica spp. (ハムシ)、*Epilachna varivestis* (インゲ
 ンテントウ)、*Faustinus cubae*、*Hylobius pales* (パレ
 ス・ウィービル (pales weevil))、*Hypera* spp. (ゾウムシ)、*Hyper*
a postica (アルファルファタコゾウムシ)、*Hyperdoes* spp. (ス
 ズメノカタビラオサゾウムシ)、*Hypothenemus hampei* (コーヒー
 ・ベリー・ビートル (coffee berry beetle))、*Ips* spp. (キクイムシ) 30
Lasioderma serricorne (タバコシバンムシ)、*Leptinota*
rsa decemlineata (コロラドハムシ)、*Liogenys fuscus*、*Liogenys*
suturalis、*Lissorhoptrus oryzo*
philus (イネミズゾウムシ)、*Lyctus* spp. (キクイムシ／ヒラタキ
 イムシ)、*Maecolaspis jolivetii*、*Megascelis* spp
 .、*Melanotus communis*、*Meligethes* spp.、*Meli*
gethes aeneus (ブロッサム・ビートル (blossom beetle))、*Melo*
lontha melolontha (ヨーロッパコフキコガネ)、*Oberia* *br*
evis、*Oberia linearis*、*Oryctes rhinoceros* (ナツメヤシビートル)
Oryzaephilus mercator (オオメノコギリ 40
 ヒラタムシ)、*Oryzaephilus surinamensis* (ノコギリヒラタ
 ムシ)、*Otioryhynchus* spp. (ゾウムシ)、*Oulema melan*
opus (シリアル・リーフ・ビートル (cereal leaf beetle))、*Oulema or*
yzae、*Pantomorus* spp. (ゾウムシ)、*Phyllophaga* sp
 p. (コガネムシ)、*Phyllophaga cuyabana*、*Phyllotr*
eta spp. (ハムシ)、*Phynchites* spp.、*Popillia j*
aponica (マメコガネ)、*Prostephanus truncatus* (オオ
 コナナガシンクイムシ)、*Rhizopertha dominica* (コナナガシンク
 イムシ)、*Rhizotrogus* spp. (ヨーロッパコガネムシ)、*Rhynch*
ophorus spp. (ゾウムシ)、*Scolytus* spp. (キクイムシ) 50

Shenophorus spp. (オサゾウムシ)、*Sitona lineatus* (アカアシチビコフキゾウムシ)、*Sitophilus* spp. (コクゾウムシ)、*Sitophilus granaries* (グラナリアコクゾウムシ)、*Sitophilus oryzae* (イネゾウムシ)、*Stegobium paniceum* (ジンサンシバンムシ)、*Tribolium* spp. (コクヌストモドキ)、*Tribolium castaneum* (コクヌストモドキ)、*Tribolium confusum* (ヒラタコクヌストモドキ)、*Trogoderma variabile* (キマダラカツオブシムシ)、及び *Zabrus tenebrioides* が含まれる。

【0065】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、革翅目 (ハサミムシ) を防除するために用いることができる。

10

【0066】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、網翅目 (ゴキブリ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Blattella germanica* (チャバネゴキブリ)、*Blatta orientalis* (トウヨウゴキブリ)、*Parcoblatta pennsylvanica*、*Periplaneta americana* (ワモンゴキブリ)、*Periplaneta australoasicae* (コワモンゴキブリ)、*Periplaneta brunnea* (トビイロゴキブリ)、*Periplaneta fuliginosa* (クロゴキブリ)、*Pyncoselus suninamensis* (オガサワラゴキブリ)、及び *Supella longipalpa* (チャオビゴキブリ) が含まれる。

20

【0067】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、双翅目 (ハエ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Aedes* spp. (カ)、*Agromyza frontella* (アルファルフア・ブロッチ・リーフマイナー (alfalfa blotch leafminer))、*Agromyza* spp. (ハモグリバエ)、*Anastrepha* spp. (ミバエ)、*Anastrepha suspense* (カリブミバエ)、*Anopheles* spp. (カ)、*Bactrocera* spp. (ミバエ)、*Bactrocera cucurbitae* (ウリミバエ)、*Bactrocera dorsalis* (ミカンコミバエ)、*Ceratitis* spp. (ミバエ)、*Ceratitis capitata* (チチュウカイミバエ)、*Chrysops* spp. (メクラアブ)、*Cochliomyia* spp. (ラセンウジバエ)、*Contarinia* spp. (タマバエ)、*Culex* spp. (カ)、*Dasineura* spp. (タマバエ)、*Dasineura brassicae* (キャベツタマバエ)、*Delia* spp.、*Delia platura* (タネバエ)、*Drosophila* spp. (ショウジョウバエ)、*Fannia* spp. (オブツバエ)、*Fannia canicularis* (ヒメイエバエ)、*Fannia scalaris* (ベンジョバエ)、*Gasterophilus intestinalis* (ウマバエ)、*Gracillia perseae*、*Haematobia irritans* (ノサシバエ)、*Hylemyia* spp. (ネクイムシ)、*Hypoderma lineatum* (キスジウシバエ)、*Liriomyza* spp. (ハモグリバエ)、*Liriomyza brassica* (マメハモグリバエ)、*Melophagus ovinus* (ヒツジシラミバエ)、*Musca* spp. (イエバエ)、*Musca autumnalis* (イエバエ (face fly))、*Musca domestica* (イエバエ)、*Oestrus ovis* (ヒツジバエ)、*Oscinella frit* (キモグリバエ)、*Pegomyia betae* (ビートリーフマイナー (beet leafminer))、*Phorbia* spp.、*Psila rosae* (キャロット・ラスト・フライ (carrot rust fly))、*Rhagoletis cerasi* (オウトウミバエ)、*Rhagoletis pomon*

30

40

50

ella (リンゴミバエ)、Sitodiplosis mosellana (ムギアカタマバエ)、Stomoxys calcitrans (サシバエ)、Tabanus spp. (ウマバエ)、及びTipula spp. (ガガンボ)が含まれる。

【0068】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、半翅目(カメムシ(true bug))を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、Acrosternum hilare (アオクサカメムシ)、Blissus leucopterus (トコジラミ)、Calocoris norvegicus (ポテト・ミリド(potato mirid))、Cimex hemipterus (ネッタイトコジラミ)、Cimex lectularius (トコジラミ)、Dagbertus fasciatus、Dichelops furcatus、Dysdercus suturellus (コットンステイナー(cotton stainer))、Edessa mediotabunda、Eurygaster maura (シリアルバグ(cereal bug))、Euschistus heros、Euschistus servus (クサギカメムシ)、Helopeltis antonii、Helopeltis theivora (ティー・ブライト・プラントバグ(tea blight plantbug))、Lagynotomus spp. (カメムシ)、Leptocorisa oratorius、Leptocorisa varicornis、Lygus spp. (カスミカメムシ)、Lygus hesperus (サビイロカスミカメ)、Macronelliticoccus hirsutus、Neurocolpus longirostris、Nezara viridula (ミナミアオカメムシ)、Phytocoris spp. (カスミカメムシ)、Phytocoris californicus、Phytocoris relativus、Piezodorus guildingii、Poecillocapsus lineatus (フォーラインド・プラントバグ(fourlined plant bug))、Psallus vaccinicola、Pseudacysta perseae、Scaptocoris castanea、及びTriatoma spp. (吸血サシガメ/サシガメ)が含まれる。

【0069】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、同翅目(アブラムシ、カイガラムシ、コナジラミ、ヨコバイ)を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、Acrythosiphon pisum (エンドウヒゲナガアブラムシ)、Adelges spp. (カサアブラムシ)、Aleurodes proletella (タマナコナジラミ)、Aleurodicus disperses、Aleurothrixus floccosus (ワタコナジラミ)、Aluacaspis spp.、Amrasca bigutella bigutella、Aphrophora spp. (ヨコバイ)、Aonidiella aurantii (アカマルカイガラムシ)、Aphis spp. (アブラムシ)、Aphis gossypii (ワタアブラムシ)、Aphis pomi (リンゴアブラムシ)、Aulacorthum solani (ジャガイモヒゲナガアブラムシ)、Bemisia spp. (コナジラミ)、Bemisia argentifolii、Bemisia tabaci (タバココナジラミ)、Brachycolus noxius (ロシアアブラムシ(Russian aphid))、Brachycorynella asparagi (アスパラガスアブラムシ(asparagus aphid))、Brevennia rehi、Brevicoryne brassicae (ダイコンアブラムシ)、Ceroplastes spp. (カイガラムシ)、Ceroplastes rubens (ルビーロウカイガラムシ)、Chionaspis spp. (カイガラムシ)、Chrysomphalus spp. (カイガラムシ)、Coccus spp. (カイガラムシ)、Dysaphis plantaginea (オオバコアブラムシ)、Empoasca spp. (ヨコバイ)、Eriosoma lanigerum (リンゴワタムシ)、Icerya purchasi (ワタフキカイガラムシ)

、*Idioscopus nitidulus* (マンゴーヨコバイ)、*Laodelphax striatellus* (ヒメトビウンカ)、*Lepidosaphes* spp.、*Macrosiphum* spp.、*Macrosiphum euphorbiae* (ジャガイモヒゲナガアブラムシ)、*Macrosiphum granarium* (イングリッシュ・グレイン・アフィド (English grain aphid))、*Macrosiphum rosae* (ローズアフィド (rose aphid))、*Macrosteles quadrilineatus* (フタテンヨコバイ)、*Mahanarva frimbriolata*、*Metopolophium dirhodum* (ムギウスイロアブラムシ)、*Mictis longicornis*、*Myzus persicae* (モモアカアブラムシ)、*Nephotettix* spp. (ヨコバイ)、*Nephotettix cinctipes* (ツマグロヨコバイ)、*Nilaparvata lugens* (トビイロウンカ)、*Parlatoria pergandii* (チャフスケール (chaff scale))、*Parlatoria ziziphi* (エボニースケール (ebony scale))、*Peregrinus maidis* (コーンデルファシド (corn delphacid))、*Philaenus* spp. (アワフキムシ)、*Phylloxera vitifoliae* (ブドウネアブラムシ)、*Physokermes piceae* (スプルース・バド・スケール (spruce bud scale))、*Planococcus* spp. (コナカイガラムシ)、*Pseudococcus* spp. (コナカイガラムシ)、*Pseudococcus brevipes* (パイナップルコナカイガラムシ)、*Quadraspidiotus perniciosus* (サンホセカイガラムシ)、*Rhapalosiphum* spp. (アブラムシ)、*Rhapalosiphum maidi* (トウモロコシアブラムシ)、*Rhapalosiphum padi* (ムギクビレアブラムシ)、*Saissetia* spp. (カイガラムシ)、*Saissetia oleae* (クロカイガラムシ)、*Schizaphis graminum* (ムギミドリアブラムシ)、*Sitobion avenae* (イングリッシュ・グレイン・アフィド (English grain aphid))、*Sogatella furcifera* (セジロウンカ)、*Therioaphis* spp. (アブラムシ)、*Toumeyella* spp. (カイガラムシ)、*Toxoptera* spp. (アブラムシ)、*Trialetrodes* spp. (コナジラミ)、*Trialetrodes vaporariorum* (オンシツコナジラミ)、*Trialetrodes abutiloneus* (バンデッドウイングホワイトフライ (bandedwing whitefly))、*Unaspis* spp. (カイガラムシ)、*Unaspis yanonensis* (ヤノネカイガラムシ)、及び *Zulia entreriana* が含まれる。

【0070】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、膜翅目 (アリ、スズメバチ、及びミツバチ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Acromyrmex* spp.、*Athalia rosae*、*Atta* spp. (ハキリアリ)、*Camponotus* spp. (オオアリ)、*Diprion* spp. (ハバチ)、*Formica* spp. (アリ)、*Iridomyrmex humilis* (アルゼンチンアリ)、*Monomorium* spp.、*Monomorium minumum* (イエヒメアリ)、*Monomorium pharaonis* (ファラオアリ)、*Neodiprion* spp. (ハバチ)、*Pogonomymex* spp. (シュウカクアリ)、*Polistes* spp. (アシナガバチ)、*Solenopsis* spp. (ヒアリ)、*Tapinoma sessile* (オドラス・ハウス・アント (odorous house ant))、*Tetranomium* spp. (シワアリ)、*Vespula* spp. (スズメバチ)、及び *Xylocopa* spp. (クマバチ) が含まれる。

【0071】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、等翅目 (シロアリ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定される

10

20

30

40

50

ものではないが、*Coptotermes* spp.、*Coptotermes curvignathus*、*Coptotermes frenchii*、*Coptotermes formosanus* (イエシロアリ)、*Cornitermes* spp. (オオシロアリ)、*Cryptotermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Heterotermes* spp. (サバクチカシロアリ)、*Heterotermes aureus*、*Kalotermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Incistitermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Macrotermes* spp. (キノコシロアリ)、*Marginitermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Microcerotermes* spp. (シュウカクシロアリ (harvester termites))、*Microtermes obesi*、*Procornitermes* spp.、*Reticulitermes* spp. (チカシロアリ)、*Reticulitermes banyulensis*、*Reticulitermes grassei*、*Reticulitermes flavipes* (トウブチカシロアリ)、*Reticulitermes hageni*、*Reticulitermes hesperus* (セイブチカシロアリ)、*Reticulitermes santonensis*、*Reticulitermes speratus*、*Reticulitermes tibialis*、*Reticulitermes virginicus*、*Schedorhinotermes* spp.、及び *Zootermopsis* spp. (シツザイシロアリ) が含まれる。

【0072】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、鱗翅目 (ガ及びチョウ) を排除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Achoea janata*、*Adoxophyes* spp.、*Adoxophyes orana*、*Agrotis* spp. (ヨトウムシ)、*Agrotis ipsilon* (タマナヤガ)、*Alabama argillacea* (ハスモンヨトウ)、*Amorbia cuneana*、*Amyelosis transitella* (ネーブルオレンジワーム (navel orangeworm))、*Anacamptodes defectoria*、*Anarsia lineatella* (モモキバガ)、*Anomis sabulifera* (ジュート・ルーパー (jute looper))、*Anticarsia gemmatilis* (ベルベットビーンキャタピラー (velvetbean caterpillar))、*Archips argyrospila* (フルーツツリーリーフローラー (fruittree leafroller))、*Archips rosana* (ローズ・リーフ・ローラー (rose leaf roller))、*Argyrotaenia* spp. (ハマキガ)、*Argyrotaenia citrana* (オレンジハマキガ)、*Autographa gamma*、*Bonagota cranaodes*、*Borbo cinnara* (コブノメイガ)、*Bucculatrix thurberiella* (コットンリーフパーフォレーター (cotton leafperforator))、*Caloptilia* spp. (ハモグリムシ)、*Capua reticulana*、*Carposina niponensis* (モモシンクイガ)、*Chilo* spp.、*Chlumetia transversa* (マンゴーフサヤガ)、*Choristoneura rosaceana* (ハスオビハマキ)、*Chrysodexis* spp.、*Cnaphalocerus medinalis* (グラスリーフローラー (grass leafroller))、*Colias* spp.、*Conpomorpha cramerella*、*Cossus cossus* (ボクトウガ)、*Crambus* spp. (ソッドウェブワーム (Sod webworms))、*Cydia funebrana* (スモモシンクイガ)、*Cydia molesta* (ナシヒメシンクイ)、*Cydia nignicana* (エンドウシンクイ)、*Cydia pomonella* (コドリンガ)、*Darna diducta*、*Diaphania* spp. (ズイムシ)、*Diatraea* spp. (ジククイムシ)、*Diatraea saccharalis* (カンショジククイムシ)、*Diatraea graniosella* (ナンセイブアワノメイガ)、*Earias* spp. (オオタバコガ

)、*Earias insulate* (エジプトタバコガ)、*Earias vitella* (ラフ・ノーザン・ボールワーム (rough northern bollworm))、*Ecdyttopha aurantianum*、*Elasmopalpus lignosellus* (モロコシマダラメイガ)、*Epiphysias postruttana* (淡褐色リンゴガ)、*Ephestia* spp. (フラワーモス (flour moths))、*Ephestia cautella* (スジマダラメイガ)、*Ephestia elutella* (チャマダラメイガ)、*Ephestia kuehniella* (スジコナマダラメイガ)、*Epimeces* spp.、*Epinotia aporema*、*Erionota thrax* (バナナセセリ)、*Eupoecilia ambiguella* (グレープ・ベリー・モス (grape berry moth))、*Euxoa auxiliaris* (アーミーカットワーム (army cutworm))、*Feltia* spp. (ヨトウムシ)、*Gortyna* spp. (ズイムシ)、*Grapholita molesta* (ナシヒメシンクイ)、*Hedylepta indicata* (ビーン・リーフ・ウェバー (bean leaf webber))、*Helicoverpa* spp. (ヤガ)、*Helicoverpa armigera* (オオタバコガ)、*Helicoverpa zea* (オオタバコガ (bollworm/corn earworm))、*Heliothis* spp. (ヤガ)、*Heliothis virescens* (オオタバコガ)、*Hellula undalis* (ハイマダラノメイガ)、*Indarbela* spp. (ネクイムシ)、*Keiferia lycopersicella* (トマトギョウチュウ)、*Leucinodes orbonalis* (ナスノメイガ)、*Leucoptera malifoliella* (グレープ・フルーツ・モス (grape fruit moth))、*Loxagrotis* spp. (ヤガ)、*Loxagrotis albicosta* (ウェスタン・ビーン・カットワーム (western bean cutworm))、*Lymantria dispar* (マイマイガ)、*Lyonetia clerkella* (リンゴハモグリムシ)、*Mahasena corbeti* (アブラヤシミノムシ)、*Malacosoma* spp. (テンマクケムシ)、*Mamestra brassicae* (ヨトウガ)、*Maruca testulalis* (マメシンクイガ)、*Metisa plana* (ミノムシ)、*Mythimna unipuncta* (アワヨトウ)、*Neoleucinodes elegantalis* (スモール・トマト・ボーラー (small tomato borer))、*Nymphula depunctalis* (イネミズメイガ)、*Operophtera brumata* (フユシャク)、*Ostrinia nubilalis* (ヨーロッパアワノメイガ)、*Oxydia vesulia*、*Pandemis cerasana* (スグリハマキガ)、*Pandemis heparana* (褐色リンゴハマキガ (brown apple tortrix))、*Papilio demodecus*、*Pectinophora gossypiella* (ワタアカミムシガ)、*Peridroma* spp. (ヨトウムシ)、*Peridroma saucia* (ニセタマナヤガ)、*Perileucoptera coffeella* (ホワイット・コーヒー・リーフマイナー (white coffee leafminer))、*Phthorimaea operculella* (ジャガイモキバガ)、*Phyllonorycter* spp. (ハモグリムシ)、*Pieris rapae* (モンシロチョウ)、*Plathypena scabra*、*Plodia interpunctella* (ノシメマダラメイガ)、*Plutella xylostella* (コナガ)、*Polychrosis viteana* (グレープ・ベリー・モス (grape berry moth))、*Prays endocarpa*、*Prays oleae* (オリーブガ)、*Pseudaletia* spp. (ヤガ)、*Pseudaletia unipunctata* (アワヨトウ)、*Pseudoplusia includens* (ダイズルーパー (soybean looper))、*Rachiplusia nu*、*Scipophaga incertulas*、*Sesamia* spp. (ズイムシ)、*Sesamia inferens* (イネヨトウ)、*Sesamia nonagrioides*、*Setora nitens*、*Sitotroga*

cerealella (バクガ)、*Sparganothis pilleriana*、*Spodoptera* spp. (アワヨトウ)、*Spodoptera exigua* (シロイチモジヨトウ)、*Spodoptera fugiperda* (アキアワヨトウ)、*Spodoptera oridania* (サザンアーミーワーム (southern armyworm))、*Synanthedon* spp. (ネクイムシ)、*Thecla basilides*、*Thermisia gemmatalis*、*Tineola bisselliella* (コイガ)、*Trichoplusia ni* (イラクサギンウワバ)、*Tuta absoluta*、*Yponomeuta* spp.、*Zeuzera coffeae* (レッド・ブランチ・ボラー (red branch borer))、及び *Zeuzera pyrina* (ゴマフボクトウ) が含まれる。

10

【0073】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、食毛目 (ハジラミ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Bovicola ovis* (ヒツジハジラミ)、*Menacanthus stramineus* (ニワトリハジラミ)、及び *Menopon gallinea* (コモン・ヘン・ラウス (common hen louse)) が含まれる。

【0074】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、直翅目 (バッタ、イナゴ、及びコオロギ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Anabrus simplex* (モルモンコオロギ)、*Gryllotalpidae* (ケラ)、*Locusta migratoria*、*Melanoplus* spp. (バッタ)、*Microcentrum retinerve* (アンギュラー・ウイングド・カティディッド (angular winged katydid))、*Pterophylla* spp. (キリギリス)、*chistocerca gregaria*、*Scudderia furcata* (フォークテイルド・ブッシュ・カティディッド (forktailed bush katydid)) 及び *Valanga nigricornis* が含まれる。

20

【0075】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、シラミ目 (シラミ (sucking lice)) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Haematopinus* spp. (ウシ及びブタシラミ)、*Linognathus ovillus* (ヒツジシラミ)、*Pediculus humanus capitis* (ヒトジラミ)、*Pediculus humanus humanus* (ヒトジラミ)、及び *Pthirus pubis* (ケジラミ) が含まれる。

30

【0076】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、ノミ目 (ノミ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Ctenocephalides canis* (イヌノミ)、*Ctenocephalides felis* (ネコノミ)、及び *Pulex irritans* (ヒトノミ) が含まれる。

40

【0077】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、総翅目 (アザミウマ) を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Frankliniella fusca* (タバコアザミウマ)、*Frankliniella occidentalis* (ミカンキイロアザミウマ)、*Frankliniella shulzei* *Frankliniella williamsi* (トウモロコシアザミウマ)、*Heliothrips haemorrhoidalis* (クロトンアザミウマ)、*Rhipiphorothrips cruentatus*、*Scirtothrips* spp.、*Scirtothrips citr*

50

i (カンキツアザミウマ)、*Scirtothrips dorsalis* (チャノキイロアザミウマ)、*Taeniothrips rhopalantennalis*、及び *Thrips* spp. が含まれる。

【0078】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、シミ目(シミ)を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Lepisma* spp. (シミ)及び*Thermobia* spp. (マダラシミ)が含まれる。

【0079】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、ダニ目(ダニ及びマダニ)を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Acarapsis woodi* (ミツバチの気管ダニ)、*Acarus* spp. (食品ダニ)、*Acarus siro* (コナダニ)、*Aceria mangiferae* (マンゴー・バド・マイト (mango bud mite))、*Aculops* spp.、*Aculops lycopersici* (トマトサビダニ)、*Aculops pelekasi*、*Aculus pelekassi*、*Aculus schlechtendali* (リンゴサビダニ)、*Amblyomma americanum* (ヒトツボシダニ)、*Boophilus* spp. (マダニ)、*Brevipalpus obovatus* (チャノヒメハダニ)、*Brevipalpus phoenicis* (レッド・アンド・ブラック・フラット・マイト (red and black flat mite))、*Demodex* spp. (ヒゼンダニ)、*Dermacentor* spp. (カタダニ)、*Dermacentor variabilis* (アメリカイヌダニ)、*Dermatophagoides pteronyssinus* (チリダニ)、*Eotetranychus* spp.、*Eotetranychus carpini* (キイロハダニ)、*Epitimerus* spp.、*Eriophyes* spp.、*Ixodes* spp. (マダニ)、*Metatetranychus* spp.、*Notoedres cati*、*Oligonychus* spp.、*Oligonychus coffee*、*Oligonychus ilicus* (サザン・レッド・マイト (southern red mite))、*Panonychus* spp.、*Panonychus citri* (ミカンハダニ)、*Panonychus ulmi* (リンゴハダニ)、*Phyllocoptuta oleivora* (ミカンサビダニ)、*Polyphagotarsonemus latus* (チャノホコリダニ)、*Rhipicephalus sanguineus* (クリイロコイタマダニ)、*Rhizoglyphus* spp. (ネダニ)、*Sarcoptes scabiei* (ヒゼンダニ)、*Tegolophus perseaflorae*、*Tetranychus* spp.、*Tetranychus urticae* (ナミハダニ)、及び*Varroa destructor* (ミツバチダニ)が含まれる。

【0080】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、線形動物門(線虫)を防除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Aphelenchoides* spp. (芽及び葉並びにマツノザイセンチュウ)、*Belonolaimus* spp. (刺咬センチュウ)、*Cricone-mella* spp. (ワセンチュウ)、*Dirofilaria immitis* (犬糸状虫)、*Ditylenchus* spp. (茎及び球根センチュウ)、*Heterodera* spp. (シストセンチュウ)、*Heterodera zeae* (トウモロコシシストセンチュウ)、*Hirschmanniella* spp. (ネセンチュウ)、*Hoplolaimus* spp. (ヤリセンチュウ)、*Meloidogyne* spp. (ネコブセンチュウ)、*Meloidogyne incognita* (ネコブセンチュウ)、*Onchocerca volvulus* (フックテールワーム)、*Pratylenchus* spp. (ネグサレセンチュウ)、*Radopholus* sp

10

20

30

40

50

p. (ネモグリセンチュウ)、及び *Rotylenchus reniformis* (キドニー・シェード・ネマトード (kidney-shaped nematode)) が含まれる。

【0081】

別の実施形態において、本明細書に開示される本発明は、コムカデ綱 (コムカデ) を排除するために用いることができる。これらの害虫の非包括的なリストには、これに限定されるものではないが、*Scutigerebella immaculata* が含まれる。

【0082】

より詳細な情報は、「Handbook of Pest Control-The Behavior, Life History, and Control of Household Pests」、Arnold Mallis、第9版、2004、GIE Media Inc.を参考にされたい。

【0083】

混合物

本明細書に開示される本発明と組み合わせて有利に用いることができるいくつかの殺虫剤には、これに限定されるものではないが、以下のものが含まれる。

1, 2-ジクロロプロパン、1, 3-ジクロロプロペン、

アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アセチオン、アセトプロール、アクリナトリン、アクリロニトリル、アラニカルブ、アラジカルブ、アルドキシカルブ、アルドリノ、アレスリン、アロサミジン、アリキシカルブ、 α -シペルメトリン、 α -エクジソン、アミジチオン、アミドフルメト、アミノカルブ、アミトン、アミトラズ、アナバシン、三酸化ヒ素、アチダチオン、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、アゾベンゼン、アゾシクロチン、アゾトエート、

ヘキサフルオロケイ酸バリウム、バルトリン、ベンクロチアズ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベノミル、ベノキサホス、ベンスルタブ、ベンゾキシメート、安息香酸ベンジル、 β -シフルトリン、 β -シペルメトリン、ビフェナザート、ビフェントリン、ビナパクリル、ピオアレトリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、ビストリフロン、ホウ砂、ホウ酸、ブロムフェンビンホス、ブローモ-DDT、ブローモシクレン、ブローモホス、ブローモホス-エチル、ブローモプロピレート、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブタカルブ、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブトネート、ブトキシカルボキシム、

カズサホス、ヒ酸カルシウム、多硫化カルシウム、カンフェクロール、カルバノレート、カルバリル、カルボフラン、二硫化炭素、四塩化炭素、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、キノメチオナート、クロラントラニルプロール、クロルベンシド、クロルビシクレン、クロルダン、クロルデコン、クロルジメホルム、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェネトール、クロルフェンソン、クロルフェンスルフィド、クロルフェンビンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロロベンジラート、クロロホルム、クロロメブホルム、クロロメチウロン、クロロピクリン、クロロプロピラート、クロルホキシム、クロルプラゾホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クロルチオホス、クロマフェノジド、シネリンI、シネリンII、シスメトリン、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロサンテル、クロチアニジン、アセト亜ヒ酸第二銅、ヒ酸銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、クマホス、クミトエート、クロタミトン、クロトキシホス、クルエンタレンA及びB、クルホメート、クリオライト、シアノフェンホス、シアノホス、シアントアート、シクレトリン、シクロプロトリン、シエノピラフェン、シフルメトフェン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シフェントリン、シロマジン、サイチオアート、

d-リモネン、ダゾメット、DBCP、DCIP、DDT、デカルボフラン、デルタメトリン、デメフィオン、デメフィオン-O、デメフィオン-S、デメトン、デメトン-メチル、デメトン-O、デメトン-O-メチル、デメトン-S、デメトン-S-メチル、デメトン-S-メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ジアミダホス、ジアジノン、ジカプトン、ジクロフェンチオン、ジクロフルアニド、ジクロルボス、ジコホル、ジクレシル、ジクロトホス、ジシクラニル、ジエルドリノ、ジエノクロル、ジフロピダジン、ジフルベンズロン、ジロール、ジメフルトリン、ジメホックス、ジメタン、ジメトア

10

20

30

40

50

ート、ジメトリン、ジメチルビンホス、ジメチラン、ジネクス、ジノブトン、ジノカップ、ジノカップー4、ジノカップー6、ジノクトン、ジノペントン、ジノプロップ、ジノサム、ジノスルホン、ジノテフラン、ジノテルボン、ジオフェノラン、ジオキサベンゾホス、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジフェニルスルホン、ジスルフィラム、ジスルホトン、ジチクロホス、DNOC、ドフェナピン、ドラメクチン、

エクジステロン、エマメクチン、EMPC、エムペントリン、エンドスルファン、エンドチオン、エンドリン、EPN、エポフェノナン、エプリノメクチン、エスフェンバレート、エタホス、エチオフェンカルブ、エチオン、エチプロール、エトアートーメチル、エトプロホス、エチルーDDD、ギ酸エチル、エチレンジプロミド、エチレンジクロリド、エチレンオキシド、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、EXD、

10

ファムファール、フェナミホス、フェナザフロール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンクロルホス、フェネタカルブ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンピリトリン、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、フェンソン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェンチオンーエチル、フェントリファニル、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリピリム、フルアズロン、フルベンジアミド、フルベンジミン、フルコフロン、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルエネチル、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルオルベンシド、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホルムパラネート、ホスメチラン、ホスピレート、ホスチアゼート、ホスチエタン、フラチオカルブ、フレスリン、フルフラール、

20

γ -シハロトリン、 γ -HCH、

ハルフェンプロックス、ハロフェノジド、HCH、HEOD、ヘブタクロル、ヘブテノホス、ヘテロホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、HHDN、ヒドラメチルノン、シアン化水素、ヒドロブレン、ヒキンカルブ、

イミシアホス、イミダクロブリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードメタン、IPSP、イサミドホス、イサゾホス、イソベンザン、イソカルボホス、イソドリン、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソプロチオラン、イソチオエート、イソキサチオン、イベルメクチン、

ジャスモリンI、ジャスモリンII、ジョドフェンホス(jodfenphos)、幼若ホルモンI、幼若ホルモンII、幼若ホルモンIII、

30

ケレバン、キノブレン、

λ -シハロトリン、ヒ酸鉛、レピメクチン、レプトホス、リンダン、リリムホス、ルフエスロン、リチダチオン、

マラチオン、マロノベン、マジドックス、メカルバム、メカルホン、メナゾン、メホスホラン、塩化第一水銀、メスルフェン、メスルフェンホス、メタフルミゾン、メタム、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メトクロトホス、メトミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、臭化メチル、メチルクロロホルム、塩化メチレン、メチルイソチオシアナート、メトフルトリン、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メピンホス、メキサカルバート、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミパホックス(mipafos)、ミレックス、MNAF、モノクロトホス、モルホチオン、モキシデクチン、

40

ナフタロホス、ナレド、ナフタレン、ニコチン、ニフルリジド、ニッコーマイシン、ニテンピラム、ニチアジン、ニトリラカルブ、ノバルロン、ノビフルムロン、

オメトエート、オキサミル、オキシデメトンーメチル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、

パラジクロロベンゼン、パラチオン、パラチオンーメチル、ペンフルロン、ペンタクロロフェノール、ペルメトリン、フェンカプトン、フェノトリン、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスホラン、ホスメット、ホスニクロル、ホスファミドン、ホスフィン、ホスホカルブ、ホキシム、ホキシムーメチル、ピリメタホス、ピリミカルブ、ピリミホス

50

ーエチル、ピリミホスーメチル、亜ヒ酸カリウム、チオシアン酸カリウム、p p'-DDT、プラレトリン、プレコセンI、プレコセンII、プレコセンIII、プリミドホス、プロクロノール、プロフェノホス、プロフルトリン、プロマシル、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギット、プロペタンホス、プロボキスル、プロチダチオン、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ピラクロホス、ピラフルプロール、ピラゾホス、ピレスメトリン、ピレトリンI、ピレトリンII、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリフルキナゾン、ピリミジフェン、ピリミタート、ピリプロール、ピリプロキシフェン、

カシア、キナルホス、キナルホスーメチル、キノチオン、クアンチオホス (quantiofos)、

10

ラホキサニド、レスメトリン、ロテノン、リアニア、

サバジラ、シュラーダン、セラメクチン、シラフルオフエン、亜ヒ酸ナトリウム、フッ化ナトリウム、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム、チオシアン酸ナトリウム、ソファミド、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルコフロン、スルフィラム、スルフルラミド、スルホテプ、硫黄、フッ化スルフリル、スルプロホス、

エーフルバリネート、タジムカルブ、TDE、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、TEPP、テラレトリン、テルブホス、テトラクロロエタン、テトラクロロピンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラナクチン、テトラスル、θ-シペルメトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チクロホス、チオカルボキシム、チオシクラム、チオジカルブ、チオフアノックス、チオメトン、チオナジン、チオキノックス、チオスルタップ (thiosultap)、ツリンギエンシン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トランスフルトリン、トランスペルメトリン、トリアラテン (triarathene)、トリアザメート、トリアゾホス、トリクロルホン、トリクロルメタホス-3、トリクロロナート、トリフェノホス、トリフルムロン、トリメタカルブ、トリブレン、

20

バミドチオン、バニリプロール、

XMC、キシリルカルブ、

ζ-シペルメトリン、及びゾラプロホス。

【0084】

30

さらに、上記の殺虫剤の任意の組み合わせを用いることができる。

【0085】

本明細書に開示される本発明は、経済的な理由及びから、除草剤及び殺真菌剤、又はその両方と共に用いることもできる。

【0086】

本明細書に開示される本発明は、経済的な理由及び相乗的な理由から、抗菌剤、殺菌剤、枯葉剤、毒性緩和剤 (safener)、相乗剤、殺藻剤、誘引剤、乾燥剤、フェロモン、忌避剤、動物浸液 (animal dip)、殺鳥剤、消毒剤、情報化学物質、及び軟体動物駆除剤 (これらの分類は必ずしも互いに排他的ではない) と共に用いることができる。

【0087】

40

さらなる情報は、本明細書の出願日時点の<http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>にある「Compendium of Pesticide Common Names」を参考にされたい。さらに、「The Pesticide Manual」、第14版、C D S Tomlin編、2006、British Crop Production Councilも参考にされたい。

【0088】

相乗的混合物

本明細書に開示される本発明は、表題「混合物」にて記述したものなどの他の化合物と共に用いて、混合物中の化合物の作用様式が同じであるか、類似しているか、又は異なる相乗的混合物を形成することができる。

【0089】

50

作用様式の例としては、これに限定されるものではないが、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤、ナトリウムチャンネルモジュレータ、キチン生合成阻害剤、GABA依存性塩素イオンチャンネルアンタゴニスト、GABA及びグルタミン酸依存性塩素イオンチャンネルアンタゴニスト、アセチルコリン受容体アゴニスト、MET I阻害剤、Mg刺激ATPアーゼ阻害剤、ニコチン性アセチルコリン受容体、中腸膜攪乱物質 (disrupter)、及び酸化的リン酸化攪乱物質が含まれる。

【0090】

さらに、以下の化合物が相乗剤として公知であり、本明細書に開示される本発明と共に用いることができる：ピペロニルブトキシド、ピプロタル (piprotal)、プロピルイソム、セサメックス、セサモリン、及びスルホキシド。

10

【0091】

製剤

殺虫剤は、その純粋な形態で施用に適していることはめったにない。殺虫剤を必要とされる濃度及び適切な形態で用いることができ、容易な適用、取扱い、輸送、貯蔵、及び最大殺虫活性を可能にするように、通常は他の物質を添加する必要がある。したがって、殺虫剤は、例えば、餌、濃縮エマルジョン、ダスト (dust)、乳化性濃縮物、燻蒸剤、ゲル、顆粒剤、マイクロカプセル化剤、種子処理剤、懸濁濃縮物、サスポエマルジョン、錠剤、水溶性液剤、水分散性顆粒剤又はドライフロアブル剤、水和剤 (wetttable powders)、及び超微量液剤に製剤化される。

【0092】

20

製剤の種類に関するさらなる情報は、「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」、Technical Monograph No.2、第5版、CropLife International(2002)を参照されたい。

【0093】

殺虫剤は、そのような殺虫剤の濃縮製剤から調製された水性懸濁液又はエマルジョンとして適用されることがもっとも多い。そのような水溶性、水懸濁性、又は乳化性製剤は、通常水和剤若しくは水分散性顆粒剤として知られる固体であるか、又は通常乳化性濃縮物若しくは水性懸濁液として知られる液体である。水和剤は、圧縮して水分散性顆粒を形成することができ、殺虫剤、担体、及び界面活性剤の緊密な混合物を含む。殺虫剤の濃度は、通常約10重量%～約90重量%である。担体は通常、アタパルジャイト粘土、モンモリロナイト粘土、珪藻土、又は精製ケイ酸塩のなかから選択される。約0.5%～約10%の水和剤を含む有効な界面活性剤は、スルホン化リグニン、濃縮ナフタレンスルホナート、ナフタレンスルホナート、アルキルベンゼンスルホナート、アルキルスルファート、及び非イオン性界面活性剤、例えばアルキルフェノールエチレンオキシド付加物のなかに見出される。

30

【0094】

殺虫剤の乳化性濃縮物は、水混和性溶媒であるか、又は水不混和性有機溶媒と乳化剤の混合物である担体に溶解された、好都合な濃度、例えば液体1リットル当たり約50～約50グラムの殺虫剤を含む。有用な有機溶媒には、芳香族、特にキシレン及び石油留分、特に石油の高沸点ナフタレン及びオレフィン部分、例えば重質芳香族ナフサが含まれる。他の有機溶媒を用いることもでき、例えば、ロジン誘導体を含むテルペン溶媒、脂肪族ケトン、例えばシクロヘキサノン、及び複合アルコール、例えば2-エトキシエタノールなどである。乳化性濃縮物の適切な乳化剤は、通常のアニオン性及び非イオン性界面活性剤から選択される。

40

【0095】

水性懸濁液は、約5重量%～約50重量%の範囲の濃度で水性担体に分散された水不溶性殺虫剤の懸濁液を含む。懸濁液は、殺虫剤を微細に粉碎し、水及び界面活性剤からなる担体に激しく混合することによって調製される。水性担体の密度及び粘度を増大するために、無機塩及び合成又は天然ゴムなどの成分も添加することができる。多くの場合、水性混合物を調製し、サンドミル、ボールミル、又はピストン型ホモジナイザなどの装置でそ

50

れを均質にすることによって、殺虫剤を同時に粉碎及び混合するのがもっとも有効である。

【0096】

殺虫剤は、土壤に適用するのに特に有用である顆粒組成物として適用することもできる。顆粒組成物は通常、粘土又は類似の物質を含む担体に分散された、約0.5重量%～約10重量%の殺虫剤を含有する。そのような組成物は通常、殺虫剤を適切な溶媒に溶解し、約0.5～約3mmの範囲の適切な粒径に予め形成された顆粒担体にそれを適用することによって調製される。そのような組成物は、担体と化合物のドウ又はペーストを製造し、押し碎き、乾燥して所望の顆粒の粒径を得ることによって製剤化することもできる。

【0097】

殺虫剤を含むダストは、粉末形態の殺虫剤を、適切なダスト状農業用担体、例えばカオリン粘土、粉碎した火山岩などと緊密に混合することによって調製される。ダストは、適切には約1%～約10%の殺虫剤を含有できる。これらは、種子粉衣として又は葉面適用剤として、ダストブロー（dust blower）機で適用できる。

【0098】

適切な有機溶媒の溶液、通常は農業化学において広く使用されている散布油（spray oil）などの石油の溶液の形態で殺虫剤を適用することは、同様に実用的である。

【0099】

殺虫剤は、エアロゾル組成物の形態でも適用できる。そのような組成物では、殺虫剤は、加圧発生噴射剤混合物である担体に溶解又は分散されている。エアロゾル組成物は容器に包装され、混合物はその容器から散布バルブを通して分配される。

【0100】

殺虫剤が食品若しくは誘引剤、又はその両方と混合されるとき、殺虫剤の餌が形成される。害虫は餌を食べるとき、殺虫剤も摂取する。餌は、顆粒、ゲル、流動性粉末、液体、又は固体の形態をとることができる。これらの餌は、害虫の潜伏場所（harborage）で用いられる。

【0101】

燻蒸剤は、比較的高い蒸気圧を有し、したがって土壤中又は閉鎖空間で害虫を殺生するのに十分な濃度のガスとして存在できる殺虫剤である。燻蒸剤の毒性は、その濃度及び暴露時間に比例する。燻蒸剤は、良好な拡散能力、及び害虫の呼吸器系に浸透するか、又は害虫の表皮を通して吸収されることによる作用を特徴とする。燻蒸剤は、ガスを密封した部屋若しくは建物において、又は特殊なチャンバにおいて、ガスを遮断するシートの下で貯蔵製品の害虫を防除するために適用される。

【0102】

殺虫剤は、様々な種類のプラスチックポリマーに殺虫剤の粒子又は液滴を懸濁することによって、マイクロカプセル化することができる。ポリマーの化学的性質を変更することによって、又は処理における因子を変化させることによって、様々な大きさ、溶解性、壁厚、及び浸透度のマイクロカプセルを形成できる。これらの因子が、内部の有効成分の放出速度を左右し、したがって製品の残留性能、作用速度、及び臭気に影響を及ぼす。

【0103】

油溶液濃縮物は、溶液中に殺虫剤を保持する溶媒に殺虫剤を溶解することによって製造される。殺虫剤の油溶液は通常、溶媒自体が殺虫作用を有し、外皮のロウ状の被覆を溶解して、殺虫剤の取り込み速度を増大するため、他の製剤より速い害虫のノックダウン及び殺生を提供する。油溶液の他の利点には、より良好な貯蔵安定性、より良好な間隙への浸透、及び脂性表面に対するより良好な付着性が含まれる。

【0104】

別の実施形態は水中油型エマルジョンであり、エマルジョンは、それぞれラメラ液晶被覆を備え、水相に分散されている油性小球を含み、各油性小球は、農業的に活性な少なくとも1種の化合物を含み、（1）少なくとも1種の非イオン性親油性界面活性剤、（2）少なくとも1種の非イオン性親水性界面活性剤、及び（3）少なくとも1種のイオン性界

10

20

30

40

50

面活性剤を含むモノラメラ又はオリゴラメラ層で個々に被覆されており、小球は、平均粒径800ナノメートル未満を有する。この実施形態に関するさらなる情報は、米国特許出願第11/495228を有する、2007年2月1日公開の米国特許出願公開第20070027034号に開示されている。簡易に用いるために、この実施形態を「OIWE」と呼ぶ。

【0105】

さらなる情報は、「Insect Pest Management」、第2版、D. Dent、CAB International(2000)を参考にされたい。さらに、より詳細な情報は、「Handbook of Pest Control-The Behavior, Life History, and Control of Household Pests」、Arnold Mallis、第9版、2004、GIE Media Inc.を参考にされたい。

10

【0106】

他の製剤成分

一般に、本明細書に開示される本発明が製剤に用いられるとき、そのような製剤は、他の成分を含有できる。これらの成分には、これに限定されるものではないが（これは非包括的であり、互いに排他的でないリストである）、湿潤剤、拡散剤、固着剤、浸透剤、緩衝剤、金属イオン封鎖剤、ドリフト低減剤、相溶化剤、消泡剤、洗浄剤、及び乳化剤が含まれる。いくつかの成分を以下に記載する。

【0107】

湿潤剤は、液体に加えたとき、液体とそれが拡散する表面との間の界面張力を低減することによって、液体の拡散力及び浸透力を増大する物質である。湿潤剤は、農薬製剤において主な2つの機能のために用いられる。加工及び製造時、水中で粉末の湿潤速度を増大して、可溶性液体の濃縮物又は懸濁濃縮物を製造する機能、並びに散布タンクでの製品と水との混合時、水和剤の湿潤時間を低減して、水分散性顆粒への水の浸透を改善する機能である。水和剤、懸濁濃縮物、及び水分散性顆粒製剤に用いられる湿潤剤の例は、ラウリル硫酸ナトリウム、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、アルキルフェノールエトキシラート、及び脂肪族アルコールエトキシラートである。

20

【0108】

分散剤は、粒子の表面に吸着し、粒子の分散状態を維持するのを助け、それらが再び凝集するのを妨げる物質である。分散剤は、製造時の分散及び懸濁を促進するため、並びに散布タンクで粒子を確実に水中に再分散させるために、農薬製剤に添加される。分散剤は、水和剤、懸濁濃縮物、及び水分散性顆粒剤に広く用いられている。分散剤として用いられる界面活性剤は、粒子表面に強力に吸着し、粒子の再凝集に対して荷電障壁又は立体障壁を提供する能力を有する。もっとも一般的に用いられる界面活性剤は、アニオン性、非イオン性、又は2つの型の混合物である。水和剤製剤の場合、もっとも一般的な分散剤は、リグノスルホン酸ナトリウムである。懸濁濃縮物の場合、高分子電解質、例えばナフタレンスルホン酸ホルムアルデヒド縮合物ナトリウムなどを用いることによって、非常に良好な吸着及び安定化が得られる。トリスチリルフェノールエトキシラートホスファートエステルも用いられる。非イオン性物質、例えばアルキルアリアルエチレンオキシド縮合物及びEO-POブロックコポリマーは、懸濁濃縮物の分散剤として、アニオン性物質と組み合わせられることがある。近年、新しいタイプの非常に分子量の大きいポリマー界面活性剤が分散剤として開発されている。これらの界面活性剤は、非常に長い疎水性の「主鎖」、及び界面活性剤の「櫛」の「歯」を形成する多数のエチレンオキシド鎖を有する。疎水性の主鎖が粒子表面上に多くの固着点を有するため、これらの高分子ポリマーは、懸濁濃縮物に非常に良好な長期安定性を付与することができる。農薬製剤に用いられる分散剤の例は、リグノスルホン酸ナトリウム、ナフタレンスルホナートホルムアルデヒド縮合物ナトリウム、トリスチリルフェノールエトキシラートホスファートエステル、脂肪族アルコールエトキシラート、アルキルエトキシラート、EO-POブロックコポリマー、及びグラフトコポリマーである。

30

40

【0109】

乳化剤は、ある液相の液滴の別の液相における懸濁を安定化する物質である。乳化剤が

50

なければ、2つの液体は2つの不混和性の液相に分離する。もっとも一般的に用いられる乳化剤のブレンドは、12以上のエチレンオキシド単位を有するアルキルフェノール又は脂肪族アルコール、及びドデシルベンゼンスルホン酸の油溶性カルシウム塩を含有する。親水親油バランス（「HLB」）の値が8～18の範囲であれば、安定性の良好なエマルジョンが通常提供される。エマルジョンの安定性は、少量のEO-POブロックコポリマー界面活性剤を添加することによって改善できることがある。

【0110】

可溶化剤は、臨界ミセル濃度より高い濃度において、水中でミセルを形成する界面活性剤である。その後、ミセルは、ミセルの疎水性部分の内部で水不溶性材料を溶解又は可溶化することができる。可溶化のために通常用いられる界面活性剤の種類は、非イオン性界面活性剤：ソルビタンモノオレアート、ソルビタンモノオレアートエトキシラート、及びメチルオレアートエステルである。

10

【0111】

界面活性剤は、標的における殺虫剤の生物学的性能を向上させるために、散布タンク混合物の補助剤として、単独で、又は鉱油若しくは植物油などの他の添加剤と共に用いられることがある。生物学的強化（bioenhancement）のために用いられる界面活性剤の種類は、一般に殺虫剤の性質及び作用様式によって決まる。しかしながら、多くの場合、非イオン性界面活性剤、例えばアルキルエトキシラート、直鎖脂肪族アルコールエトキシラート、脂肪族アミンエトキシラートなどである。

20

【0112】

農薬製剤の担体又は希釈剤は、製品に必要とされる強度を付与するために殺虫剤に添加される材料である。担体は通常高い吸収能を有する材料であり、希釈剤は通常低い吸収能を有する材料である。担体及び希釈剤は、ダスト、水和剤、顆粒剤、及び水分散性顆粒剤の製剤に用いられる。

【0113】

有機溶媒は、主に乳化性濃縮物の製剤、超微量製剤に用いられ、より少ない程度で顆粒製剤に用いられる。溶媒の混合物が用いられることもある。溶媒の第1の主なグループは、脂肪族パラフィン油、例えば灯油又は精製パラフィンである。第2の主なグループは、もっとも一般的には、芳香族溶媒、例えばキシレン、並びにC9及びC10芳香族溶媒の高分子量画分を含む。塩素化炭化水素は、製剤を水に乳化するとき、殺虫剤の結晶化を防ぐために共溶媒として有用である。溶媒力を増大するために、共溶媒としてアルコールが用いられることがある。

30

【0114】

増粘剤又はゲル化剤は、液体のレオロジー又は流動特性を改変し、分散した粒子又は液滴の分離及び沈降を防ぐために、主に懸濁濃縮物、エマルジョン、及びサスポエマルジョンの製剤に用いられる。増粘剤、ゲル化剤、及び沈降防止剤は、一般に2つの分類、すなわち水不溶性粒子及び水溶性ポリマーに分けられる。粘土及びシリカを用いて、懸濁濃縮物製剤を生成することが可能である。これらの種類の材料の例としては、これに限定されるものではないが、モンモリロナイト、例えばベントナイト、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、及びアタパルジャイトが含まれる。水溶性多糖は、増粘-ゲル化剤として長年用いられてきた。もっとも一般的に用いられる多糖の種類は、天然種子及び海藻抽出物、又は合成セルロース誘導体である。これらの種類の材料の例としては、これに限定されるものではないが、グアーガム、ローカストビーンガム、カラギーナン、アルギン酸塩、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム（SCMC）、ヒドロキシエチルセルロース（HEC）が含まれる。他の種類の沈降防止剤は、加工デンプン、ポリアクリラート、ポリビニルアルコール、及びポリエチレンオキシドをベースにしたものである。他の良好な沈降防止剤は、キサンタンガムである。

40

【0115】

微生物は、製剤化した製品を損傷する。したがって、それらの影響を排除又は低減するために、保存剤が用いられる。そのような作用剤の例としては、これに限定されるもので

50

はないが、プロピオン酸及びそのナトリウム塩、ソルビン酸及びそのナトリウム又はカリウム塩、安息香酸及びそのナトリウム塩、p-ヒドロキシ安息香酸ナトリウム塩、メチル p-ヒドロキシベンゾアート、及び1, 2-ベンゾイソチアザリネ-3-オン (BIT) が含まれる。

【0116】

界面張力を下げる界面活性剤の存在は、多くの場合、生成時及び散布タンクによる適用時の混合操作中、水をベースとする製剤を発泡させる。発泡傾向を低減するために、生成段階中又はボトル充填前に、しばしば消泡剤が添加される。一般に、2つの種類の消泡剤、すなわちシリコン及び非シリコンの消泡剤が存在する。シリコンは、通常ジメチルポリシロキサンの水性エマルジョンであり、非シリコン消泡剤は、水不溶性油、例えばオクタノール及びノナノール、又はシリカである。いずれの場合も、消泡剤の機能は、界面活性剤を空気-水界面から移動させることである。

10

【0117】

さらなる情報は、「Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations」、D. A. Knowles編、1998、Kluwer Academic Publishersを参照されたい。また、「Insecticides in Agriculture and Environment-Retrospects and Prospects」、A. S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya、及びR. Perry、1998、Springer-Verlagも参照されたい。

【0118】

適用

害虫の場所 (loci) に適用される殺虫剤の実際の量は一般に決定的でなく、当業者は容易に決定できる。一般に1ヘクタール当たり殺虫剤約0.01グラム〜1ヘクタール当たり殺虫剤約5000グラムの濃度が、良好な防除を提供すると预期される。

20

【0119】

殺虫剤を適用する場所は、害虫が生息する任意の場所、例えば野菜作物、果実及び堅果の木、ブドウのツル、観賞植物、家畜、建物の内部表面又は外部表面、並びに建物周囲の土壌であることができる。害虫の防除は一般に、ある場所で害虫の個体群、活動、又はその両方を低減する手段である。これは、害虫個体群がある場所から撃退されたとき、又は害虫がある場所若しくはその周囲で、部分的若しくは完全に、一時的若しくは永続的に能力を奪われたとき、又は害虫がある場所若しくはその周囲で、全体として又は部分的に絶滅したときに起こり得る。当然ながら、これらの結果の組み合わせが起こり得る。一般に、害虫の個体群、活動、又はその両方は、望ましくは50パーセント超、好ましくは90パーセント超、さらに好ましくは99%超低減される。

30

【0120】

一般に、餌の場合、餌は、例えばシロアリがその餌と接触する可能性のある地面に配置される。餌はまた、例えばアリ、シロアリ、ゴキブリ、及びハエが餌と接触する可能性のある建物の表面 (水平面、垂直面、又は斜面) に適用することもできる。

【0121】

一部の害虫の卵には殺虫剤に抵抗する独特な能力があるため、新しく出現する幼虫を防除するために、反復適用が望ましい可能性がある。

【0122】

植物における殺虫剤の浸透性移動を利用して、殺虫剤をその植物の異なる部分、又は植物の根系が殺虫剤を取り込むことのできる位置に適用することによって、植物のある部分の害虫を防除することができる。例えば、葉採食性昆虫の防除は、点滴灌漑若しくは畦間適用によって、又は植え付け前に種子を処理することによって、防除することができる。種子の処理は、すべての種類の種子に適用することができ、特殊化された形質を発現するように遺伝的に形質転換された植物が発芽する種子が含まれる。代表的な例としては、*Bacillus thuringiensis* 若しくは他の殺虫性毒素など、無脊椎害虫に毒性であるタンパク質を発現するもの、「Roundup Ready」など、除草剤抵抗性を発現するもの、又は殺虫性毒素、除草剤抵抗性、栄養強化、若しくは他の任意の有益な形質を発現する「積層された」外来遺伝子を有するものが含まれる。さらに、本明

40

50

細書に開示される本発明によるそのような種子の処理は、ストレスの多い成長条件により良く耐える植物の能力をさらに増強することができる。これにより、収穫期に高い収量を生じることのできる、より健康で元気な植物が得られる。

【0123】

本発明を、*Bacillus thuringiensis* 若しくは他の殺虫性毒素など、特殊化された形質を発現するように遺伝的に形質転換された植物、又は除草剤抵抗性を発現するもの、又は殺虫性毒素、除草剤抵抗性、栄養強化、若しくは他の任意の有益な形質を発現する「積層された」外来遺伝子を有するものと共に使用できることが、容易に明らかとなるはずである。そのような使用の例は、本明細書に開示される本発明をそのような植物に散布することである。

10

【0124】

本明細書に開示される本発明は、獣医学の分野において、又は動物飼育の分野において、内部寄生虫及び外部寄生虫を防除するのに適している。本発明による化合物は、公知の方法、例えば錠剤、カプセル剤、飲料、顆粒剤の形態での経口投与、例えば浸漬、散布、注ぐ、スポッティング、及び散粉の形態での皮膚適用、並びに例えば注射の形態での非経口投与によって適用される。

【0125】

本明細書に開示される本発明は、ウシ、ヒツジ、ブタ、ニワトリ、及びガチョウなどの家畜の飼育においても有利に用いることができる。適切な製剤を、飲料水又は飼料と共に動物に経口で投与する。適切な投与量及び製剤は種によって決まる。

20

【0126】

殺虫剤を使用又は市販できるまでに、そのような殺虫剤は、様々な政府機関（地方、地域、州、国、国際）による長い評価プロセスを経る。必要とされる多量のデータが監督機関によって明記され、それは製品登録者又は製品登録者の代理人によるデータの生成及び提出によって対処されなければならない。次いで、これらの政府機関は、そのようなデータを再検討し、安全であると判定された場合、見込まれる使用者又は販売者に製品登録認可を与える。その後、製品の登録が許可され支持される地方において、使用者又は販売者はそのような殺虫剤を使用又は販売することができる。

【0127】

本明細書の表題は便宜上のものにすぎず、本明細書のいかなる部分を解釈するためにも用いてはならない。

30

フロントページの続き

- (74)代理人 100104282
弁理士 鈴木 康仁
- (72)発明者 ニュージェント, ベンジャミン
アメリカ合衆国 インディアナ州 46112, ブラウンズパーク, キング フィッシャー ドラ
イブ 794
- (72)発明者 ベンコー, ゴルタン
アメリカ合衆国 インディアナ州 46240, インディアナポリス, ノース パーク アベニ
ュー 8402
- (72)発明者 レンガ, ジェームズ
アメリカ合衆国 インディアナ州 46220, インディアナポリス, ノース セントラル アベ
ニュー 5801
- (72)発明者 ロソ, ミッチェル
アメリカ合衆国 インディアナ州 46032, カーマル, サットン プレイス ドライブ 11
439
- (72)発明者 マーティン, ティモシー
アメリカ合衆国 インディアナ州 46062, ノーブルズビル, ラムジー ドライブ 6095

審査官 品川 陽子

- (56)参考文献 国際公開第2008/030266 (WO, A1)
特表2007-532568 (JP, A)
国際公開第2008/057129 (WO, A1)
国際公開第2008/057130 (WO, A1)
特表2010-534659 (JP, A)
国際公開第2006/037945 (WO, A1)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
A01N 47/40
A01P 7/00
CAplus/REGISTRY (STN)