(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2014-201535
(P2014-201535A)
(43)公開日　平成26年10月27日(2014.10.27)

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
C07D 307/45	(2006.01)	C07D 307/45	CSP	4C023
A01N 53/04	(2006.01)	A01N 53/00	504A	4C037
A01P 7/04	(2006.01)	A01P 7/04		4H011
A01P 7/02	(2006.01)	A01P 7/02		
C07D 333/16	(2006.01)	C07D 333/16		

審査請求 未請求　請求項の数 8　ＯＬ　（全 21 頁）

(21)出願番号　特願2013-77383(P2013-77383)
(22)出願日　平成25年4月3日(2013.4.3)

(71)出願人　000207584
大日本除蟲菊株式会社
大阪府大阪市西区土佐堀１丁目４番１１号
(72)発明者　松尾　憲忠
大阪府豊中市大黒町１丁目１番１１号　大日本除蟲菊株式会社内
(72)発明者　神崎　務
大阪府豊中市大黒町１丁目１番１１号　大日本除蟲菊株式会社内
(72)発明者　勝田　純郎
大阪府豊中市大黒町１丁目１番１１号　大日本除蟲菊株式会社内

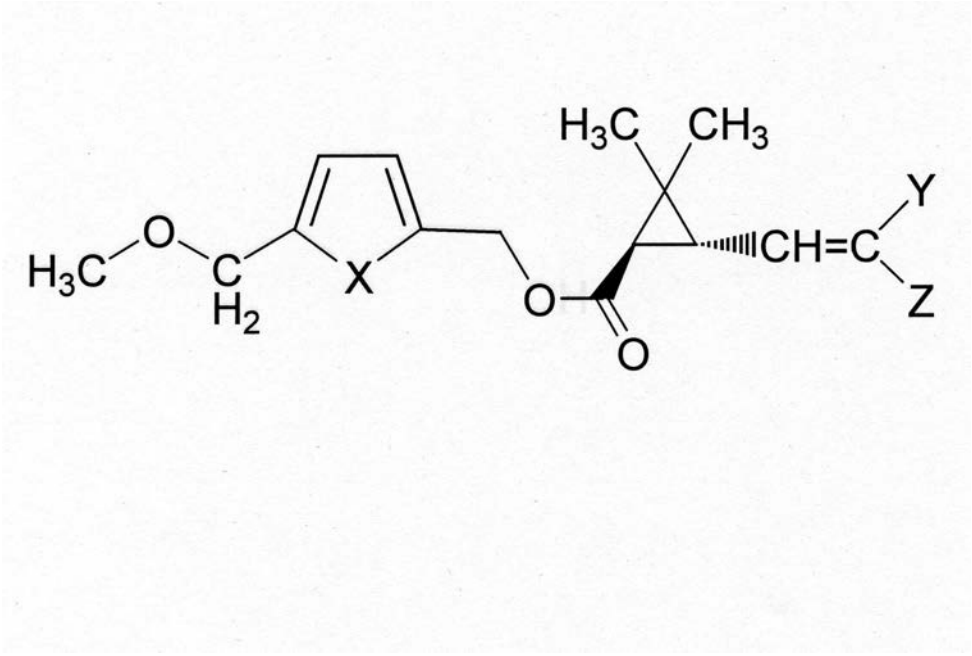
Ｆターム(参考)　4C023 BA03
4C037 HA13

最終頁に続く

(54)【発明の名称】トランスエステル化合物及びその用途

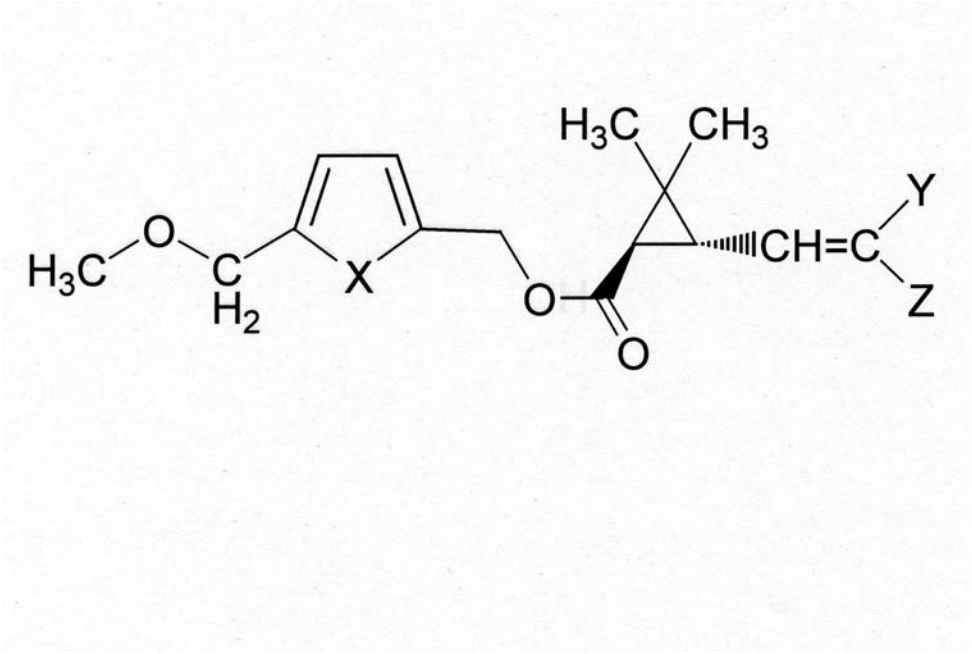
(57)【要約】　（修正有）
【課題】有害生物防除効力を有する化合物の提供。
【解決手段】３位に特定の不飽和基を有する、トランス－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボン酸、またはその反応性誘導体と、５－メトキシメチル－２－フランメタノールまたは５－メトキシメチル－２－チオフェンメタノールとを反応させて得られるトランスエステル化合物。該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤。該化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。
【選択図】なし

【特許請求の範囲】
【請求項１】
一般式［化１］
【化１】



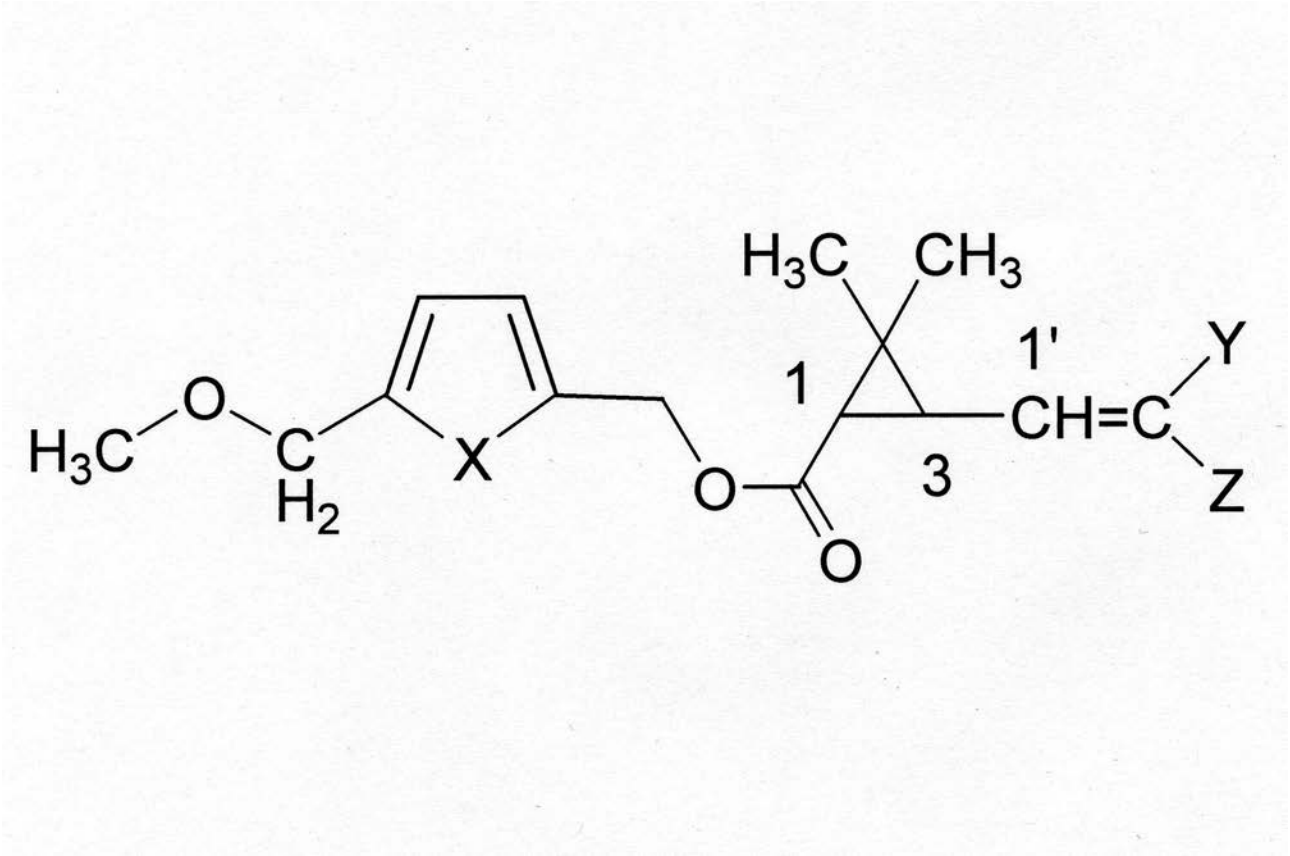
〔式中、Ｘは酸素原子、または硫黄原子のいずれかを表し、Ｙはメチル基または塩素原子を表し、Ｙがメチル基の時、Ｚは水素原子またはメチル基を表し、Ｙが塩素原子の時、Ｚは塩素原子を表す。〕
で示されるトランスエステル化合物。
【請求項２】
前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子である請求項１に記載のトランスエステル化合物。
【請求項３】
前記一般式［化１］において、Ｘが硫黄原子である請求項１に記載のトランスエステル化合物。
【請求項４】
前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、ＹおよびＺがメチル基である請求項１に記載のトランスエステル化合物。
【請求項５】
前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、ＹおよびＺが塩素原子である請求項１に記載のトランスエステル化合物。
【請求項６】
前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、Ｙがメチル基、Ｚが水素原子である請求項１に記載のトランスエステル化合物。
【請求項７】
請求項１ないし６のいずれか１項に記載のトランスエステル化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤。
【請求項８】
請求項１ないし６のいずれか１項に記載のトランスエステル化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】

【０００１】
本発明は、トランスエステル化合物及びその用途に関する。
【背景技術】
【０００２】
従来、有害生物を防除するために種々の化合物が合成されている（非特許文献１参照）。また、特許文献１には、ある種のエステル化合物が記載されている。しかしながら、これらの有害生物防除効力は必ずしも満足のいくものではない。
【先行技術文献】
【特許文献】
【０００３】
【特許文献１】特開平６－２５２０５号公報
【非特許文献】
【０００４】
【非特許文献１】「続医薬品の開発　第１８巻　農薬の開発III」、廣川書店、１９９３年、ｐ．４９３
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００５】
本発明は、優れた有害生物防除効力を有する新規なエステル化合物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】
本発明者らは、鋭意検討を行った結果、下記一般式［化１］で示されるトランスエステル化合物が優れた有害生物防除効力を有することを見出し、本発明を完成するに至った。
【０００７】
即ち、本発明は、以下の発明に係るものである。
（１）一般式［化１］
【化１】

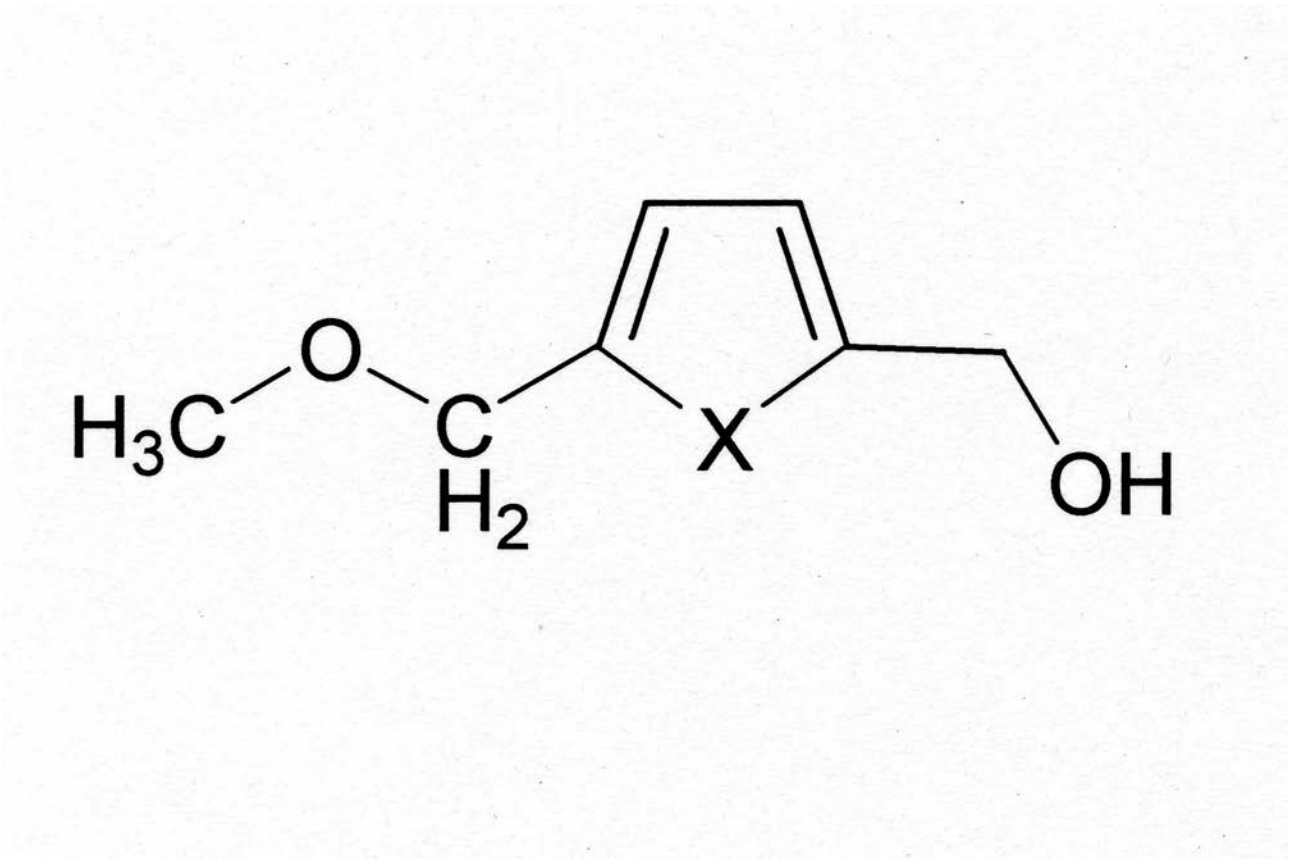


〔式中、Ｘは酸素原子、または硫黄原子のいずれかを表し、Ｙはメチル基または塩素原子を表し、Ｙがメチル基の時、Ｚは水素原子またはメチル基を表し、Ｙが塩素原子の時、Ｚは塩素原子を表す。〕

で示されるトランスエステル化合物（以下、本発明化合物と記す。）。
（２）前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子である（１）に記載のトランスエステル化合物。
（３）前記一般式［化１］において、Ｘが硫黄原子である（１）に記載のトランスエステル化合物。
（４）前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、ＹおよびＺがメチル基である（１）に記載のトランスエステル化合物。
（５）前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、ＹおよびＺが塩素原子である（１）に記載のトランスエステル化合物。
（６）前記一般式［化１］において、Ｘが酸素原子、Ｙがメチル基、Ｚが水素原子である（１）に記載のトランスエステル化合物。
（７）（１）ないし（６）のいずれか１に記載のトランスエステル化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤。
（８）（１）ないし（６）のいずれか１に記載のトランスエステル化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。
【発明の効果】
【０００８】
本発明化合物は優れた有害生物防除効力を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。
【発明を実施するための形態】
【０００９】
本発明化合物には、シクロプロパン環上の１位および３位に存在する２個の不斉炭素原子に由来する光学異性体、並びに、シクロプロパン環３位の置換基に存在する１’位の二重結合に由来する異性体が存在するが、本発明には有害生物防除活性を有する各異性体および任意の比率の異性体混合物が含まれる。
【００１０】
即ち、一般式［化２］
【化２】

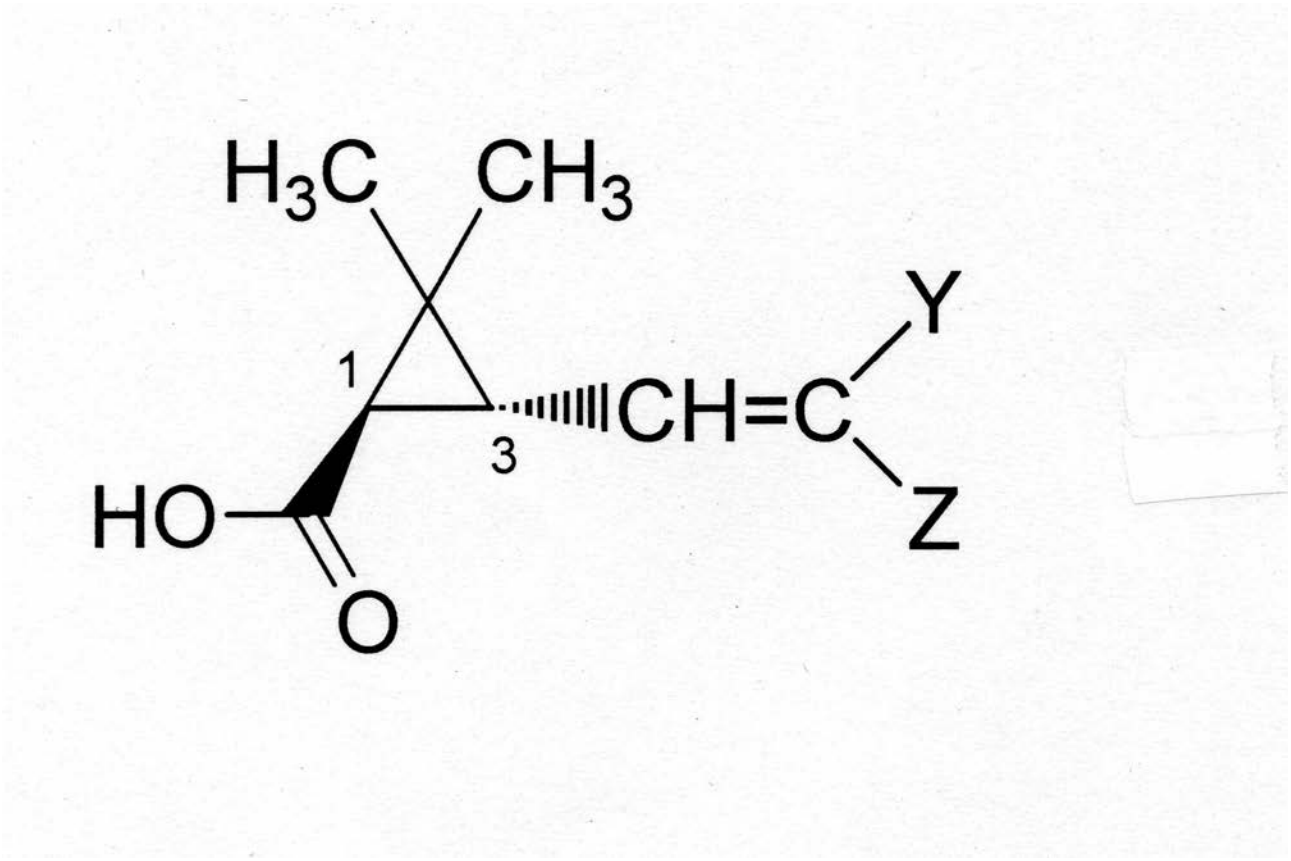


において、シクロプロパン環１位の置換基とシクロプロパン環３位の置換基との相対立体配置がトランス配置である化合物；
一般式［化２］において、シクロプロパン環１位の絶対立体配置がＲ配置であり、シクロプロパン環１位の置換基とシクロプロパン環３位の置換基との相対立体配置がトランス配置である化合物；
一般式［化２］において、Ｙがメチル基、Ｚが水素原子を表す時、シクロプロパン環１位の置換基とシクロプロパン環３位の置換基との相対立体配置がトランス配置であり、シクロプロパン環３位の置換基に存在する１’位の二重結合の相対配置がＺ配置である化合物；
一般式［化２］において、Ｙがメチル基、Ｚが水素原子を表す時、シクロプロパン環１位の絶対立体配置がＲ配置であり、シクロプロパン環１位の置換基とシクロプロパン環３位の置換基との相対立体配置がトランス配置であり、シクロプロパン環３位の置換基に存在する１’位の二重結合の相対配置がＥ配置である化合物；
【００１１】
一般式［化２］において、Ｘが酸素原子である化合物。
一般式［化２］において、Ｘが硫黄原子である化合物。
【００１２】
次に本発明化合物の製造法について説明する。
本発明化合物は、例えば以下に示す方法により製造することができる。
（製造法１）
一般式［化３］
【化３】



〔式中、Ｘは前記と同じ意味を表す。〕で示されるアルコール化合物と、

一般式［化４］
【化４】



〔式中、ＹおよびＺは前記と同じ意味を表す。〕で示されるカルボン酸化合物又はその反応性誘導体とを反応させる方法。

【００１３】

該反応性誘導体としては、一般式［化４］で示されるカルボン酸化合物の酸ハロゲン化物、該カルボン酸化合物の酸無水物および該カルボン酸化合物のエステル等が挙げられる。
該酸ハロゲン化物としては、酸クロライド化合物が挙げられ、エステルとしてはメチルエステル、エチルエステルなどが挙げられる。
該反応は、通常、縮合剤又は塩基の存在下、溶媒中で行なわれる。
縮合剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド　ハイドロクロライドが挙げられ、また、
塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、４－ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。
溶媒としては、例えばトルエン及びヘキサン等の炭化水素、テトラヒドロフラン等のエーテル、エチルアセテートなどのエステル、並びに、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、及びこれらの混合溶媒等が挙げられる。

【００１４】

該反応において、一般式［化３］で示されるアルコール化合物と、一般式［化４］で示されるカルボン酸化合物又はその反応性誘導体の使用モル比は任意に設定できるが、好ましくは、等モル又はそれに近い比である。
縮合剤又は塩基は、一般式［化３］で示されるアルコール化合物１モルに対して、通常は０．２５モルから過剰量まで任意の割合で使用することができ、好ましくは０．５モル～２モルである。これらの縮合剤又は塩基は、一般式［化４］で示されるカルボン酸化合物又はその反応性誘導体の種類により適宜選択される。

反応終了後の反応混合物は、これを濾過して濾液を濃縮する、又は、これを水に注加した後に有機溶媒抽出、濃縮する等の通常の後処理操作を施すことにより、本発明化合物を得ることができる。得られた本発明化合物はクロマトグラフィー、蒸留等の操作によって精製することができる。

【００１５】

一般式［化３］で示されるアルコール化合物は市販品またはJournal of Chemical Society(1952) 3608-10に記載の公知化合物であり、市販品を購入、または該文献に記載の方法で製造することができる。

一方、一般式［化４］で示されるカルボン酸化合物又はその反応性誘導体は市販品またはSynthetic Communications(2004) 34巻1001-10に記載の公知化合物であり、市販品を購入、または該文献に記載の方法で製造することができる。

【００１６】

本発明の有害生物防除剤は本発明化合物そのものでもよいが、通常は下記のような製剤として使用する。その製剤としては、例えば、蚊取線香、蚊取マットや蚊取リキッドのような加熱蒸散剤、ファン式蚊取、油剤、乳剤、エアゾール剤、炭酸ガス製剤、水和剤、フロアブル剤（水中懸濁剤、水中乳濁剤等）、マイクロカプセル剤、粉剤、粒剤、錠剤、ピエゾ式殺虫製剤、加熱燻煙剤（自己燃焼型燻煙剤、化学反応型燻煙剤、多孔セラミック板燻煙剤等）、非加熱蒸散剤（樹脂蒸散剤、紙蒸散剤、不織布蒸散剤、編織物蒸散剤、昇華性錠剤等）、煙霧剤（フォッギング剤）、直接接触剤（シート状接触剤、テープ状接触剤、ネット状接触剤等）、ＵＬＶ剤及び毒餌などが挙げられる。

【００１７】

製剤化の方法としては、例えば以下の方法を挙げることができる。

（１）本発明化合物を、固体担体、液体担体、ガス状担体、餌等と混合し、必要に応じて界面活性剤その他の製剤用補助剤を添加・加工する方法。

（２）本発明化合物を、有効成分を含有していない基材に含浸する方法。

（３）本発明化合物及び基材を混合した後に成形加工する方法。

これらの製剤には、製剤形態にもよるが、通常、本発明化合物を重量比で０．００１～９８％含有する。

【００１８】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、活性炭、炭酸カルシウム、シリカ等）等の微粉末及び粒状物、常温で固体の物質（２，４，６－トリイソプロピル－１，３，５－トリオキサン、ナフタリン、ｐ－ジクロロベンゼン、樟脳、アダマンタン等）、並びに羊毛、絹、綿、麻、パルプ、合成樹脂（例えば、低密度ポリエチレン、直鎖状低密度ポリエチレン、高密度ポリエチレン等のポリエチレン系樹脂；エチレン－酢酸ビニル共重合体等のエチレン－ビニルエステル共重合体；エチレン－メタクリル酸メチル共重合体、エチレン－メタクリル酸エチル共重合体等のエチレン－メタクリル酸エステル共重合体；エチレン－アクリル酸メチル共重合体、エチレン－アクリル酸エチル共重合体等のエチレン－アクリル酸エステル共重合体；エチレン－アクリル酸共重合体等のエチレン－ビニルカルボン酸共重合体；ポリプロピレン、プロピレン－エチレン共重合体等のポリプロピレン系樹脂；ポリ－４－メチルペンテン－１、ポリブテン－１、ポリブタジエン、ポリスチレン；アクリロニトリル－スチレン樹脂；アクリロニトリル－ブタジエン－スチレン樹脂、スチレン－共役ジエンブロック共重合体、スチレン－共役ジエンブロック共重合体水素添加物等のスチレン系エラストマー；フッ素樹脂；ポリメタクリル酸メチル等のアクリル系樹脂；ナイロン６、ナイロン６６等のポリアミド系樹脂；ポリエチレンテレフタレート、ポリエチレンナフタレート、ポリブチレンテレフタレエート等のポリエステル系樹脂；ポリカーボネート、ポリアセタール、ポリアリレート、ヒドロキシ安息香酸ポリエステル、ポリエーテルイミド、ポリエステルカーボネート、ポリフェニレンエーテル樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化

ビニリデン、ポリウレタン、発泡ポリウレタン、発泡ポリプロピレン、発泡エチレン等の多孔質樹脂）、ガラス、金属、セラミック等の１種または２種以上からなるフェルト、繊維、布、編物、シート、紙、糸、発泡体、多孔質体及びマルチフィラメントが挙げられる。

【００１９】

液体担体としては、例えば芳香族または脂肪族炭化水素類（キシレン、アルキルナフタレン、フェニルキシリルエタン、ケロシン、軽油、ヘキサン、シクロヘキサン等）、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール等）、エーテル類（ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、テトラヒドロフラン等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、スルホキシド類（ジメチルスルホキシド等）、酸アミド類（Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ－メチル－ピロリドン等）、炭酸アルキリデン類（炭酸プロピレン等）、植物油（大豆油、綿実油等）、植物精油（オレンジ油、ヒソップ油、レモン油等）、及び水が挙げられる。

【００２０】

ガス状担体としては、例えばブタンガス、フロンガス、液化石油ガス（ＬＰＧ）、ジメチルエーテル、及び炭酸ガス等の圧縮ガスが挙げられる。

【００２１】

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類、アルキルアリールエーテル類のポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類及び糖アルコール誘導体が挙げられる。

【００２２】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、多糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン）、ポリアクリル酸等、ＢＨＴ（２，６－ジ－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メチルフェノール）、及びＢＨＡ（２－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェノールと３－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェノールとの混合物）が挙げられる。更に、必要に応じて着色剤や香料等が適宜配合されても構わない。

【００２３】

蚊取線香の基材としては、例えば木粉、除虫菊抽出粕粉等の植物性粉末とタブ粉、澱粉、カルボキシメチルセルロース、グルテン等の結合剤との混合物が挙げられる。

蚊取マットの基材としては、例えばコットンリンターを板状に固めたもの、及びコットンリンターとパルプとの混合物のフィリブルを板状に固めたものが挙げられる。

自己燃焼型燻煙剤の基材としては、例えば、硝酸塩、亜硝酸塩、グアニジン塩、塩素酸カリウム、ニトロセルロース、エチルセルロース、木粉等の燃焼発熱剤、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩の熱分解刺激剤、硝酸カリウム等の酸素供給剤、メラミン、小麦デンプン等の支燃剤、珪藻土等の増量剤及び合成糊料等の結合剤が挙げられる。

【００２４】

化学反応型燻煙剤の基材としては、例えば、アルカリ金属の硫化物、多硫化物、水硫化物、酸化カルシウム等の発熱剤、炭化鉄、活性白土等の触媒剤、アゾジカルボンアミド、ベンゼンスルホニルヒドラジド、ジニトロペンタメチレンテトラミン、ポリスチレン、ポリウレタン等の有機発泡剤、及び、天然繊維片、合成繊維片等の充填剤が挙げられる。

【００２５】

樹脂蒸散剤等の基材に用いられる樹脂としては、例えば、低密度ポリエチレン、直鎖状低密度ポリエチレン、高密度ポリエチレン等のポリエチレン系樹脂；エチレン－酢酸ビニル

共重合体等のエチレン－ビニルエステル共重合体；エチレン－メタクリル酸メチル共重合体、エチレン－メタクリル酸エチル共重合体等のエチレン－メタクリル酸エステル共重合体；エチレン－アクリル酸メチル共重合体、エチレン－アクリル酸エチル共重合体等のエチレン－アクリル酸エステル共重合体；エチレン－アクリル酸共重合体等のエチレン－ビニルカルボン酸共重合体；ポリプロピレン、プロピレン－エチレン共重合体等のポリプロピレン系樹脂；ポリ－４－メチルペンテン－１、ポリブテン－１、ポリブタジエン、ポリスチレン、アクリロニトリル－スチレン樹脂；アクリロニトリル－ブタジエン－スチレン樹脂、スチレン－共役ジエンブロック共重合体、スチレン－共役ジエンブロック共重合体水素添加物等のスチレン系エラストマー；フッ素樹脂；ポリメタクリル酸メチル等のアクリル酸樹脂；ナイロン６、ナイロン６６等のポリアミド系樹脂；ポリエチレンテレフタレート、ポリエチレンナフタレート、ポリブチレンフタレート等のポリエステル系樹脂；ポリカーボネート、ポリアセタール、ポリアリレート、ヒドロキシ安息香酸ポリエステル、ポリエーテルイミド、ポリエステルカーボネート、ポリフェニレンエーテル樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、ポリウレタン等が挙げられ、これらの基材は、単独で用いても２種以上の混合物として用いても良く、これらの基材には必要によりフタル酸エステル類（フタル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル等）、アジピン酸エステル類、ステアリン酸等の可塑剤が添加されていてもよい。樹脂蒸散剤は、本発明化合物を上記基材中に混練した後、射出成型、押出成型、プレス成型等により成型することにより得ることができる。得られた樹脂製剤は、必要により更に成型、裁断等の工程を経て、板状、フィルム状、テープ状、網状、ひも状等の形状に加工することもできる。これらの樹脂製剤は、例えば、非加熱蒸散剤、動物用首輪、動物用イヤータッグ、シート製剤、誘引テープ、誘引紐、園芸用支柱として加工される。

【００２６】

毒餌の基材としては、例えば、穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ＢＨＴ、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ粉末等の子どもやペットによる誤食防止剤、及びチーズ香料、タマネギ香料、ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料があげられる。

【００２７】

本発明化合物は他の殺虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、忌避剤、共力剤、肥料、土壌改良剤と混用または併用して用いることもできる。

【００２８】

かかる殺虫剤、殺ダニ剤の有効成分としては、例えば、

（１）合成ピレスロイド系化合物

ピレトリン（ｐｙｒｅｔｈｒｉｎｓ）、アレスリン（ａｌｌｅｔｈｒｉｎ）、プラレトリン（ｐｒａｌｌｅｔｈｒｉｎ）、フラメトリン（ｆｕｒａｍｅｔｈｒｉｎ）、レスメトリン（ｒｅｓｍｅｔｈｒｉｎ）、テトラメトリン（ｔｅｔｒａｍｅｔｈｒｉｎ）、イミプロトリン（ｉｍｉｐｒｏｔｈｒｉｎ）、エンペントリン（ｅｍｐｅｎｔｈｒｉｎ）、トランスフルトリン（ｔｒａｎｓｆｌｕｔｈｒｉｎ）、メトフルトリン（ｍｅｔｏｆｌｕｔｈｒｉｎ）、プロフルトリン（ｐｒｏｆｌｕｔｈｒｉｎ）、フェノトリン（ｐｈｅｎｏｔｈｒｉｎ）、シフェノトリン（ｃｙｐｈｅｎｏｔｈｒｉｎ）、ペルメトリン（ｐｅｒｍｅｔｈｒｉｎ）、シペルメトリン（ｃｙｐｅｒｍｅｔｈｒｉｎ）、シフルトリン（ｃｙｆｌｕｔｈｒｉｎ）、ベーターシフルトリン（ｂｅｔａ－ｃｙｆｌｕｔｈｒｉｎ）、フェンプロパトリン（ｆｅｎｐｒｏｐａｔｈｒｉｎ）、ビフェントリン（ｂｉｆｅｎｔｈｒｉｎ）、シクロプロトリン（ｃｙｃｌｏｐｒｏｔｈｒｉｎ）、デルタメトリン（ｄｅｌｔａｍｅｔｈｒｉｎ）、フルメトリン（ｆｌｕｍｅｔｈｒｉｎ）、アクリナトリン（ａｃｒｉｎａｔｈｒｉｎ）、トラロメトリン（ｔｒａｌｏｍｅｔｈｒｉｎ）、シハロトリン（ｃｙｈａｌｏｔｈｒｉｎ）、ラムダシハロトリン（ｌａｍｂｄａ－ｃｙｈａｌｏｔｈｒｉｎ）、テフルトリン（ｔｅｆｌｕｔｈｒｉｎ）、フェンバレレート（ｆｅｎｖａｌｅｒａｔｅ）、フルバリネート（ｆｌｕｖａｌｉｎａｔｅ）、エトフェンプロックス（ｅｔｈｏｆｅｎｐｒｏｘ）、シラフルオフェン（ｓｉｌａｆｌｕｏｆｅｎ）、ジメフルトリン（ｄｉｍｅｆｌ

ｕｔｈｒｉｎ）、２，３，５，６－テトラフルオロ－４－（メトキシメチル）ベンジル＝２，２，３，３－テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート等；
（２）有機リン系化合物
アセフェート（ａｃｅｐｈａｔｅ）、ブタチオホス（ｂｕｔａｔｈｉｏｆｏｓ）、ダイアジノン（ｄｉａｚｉｎｏｎ）、ジクロルボス（ｄｉｃｈｌｏｒｖｏｓ：ＤＤＶＰ）、ジメトエート（ｄｉｍｅｔｈｏａｔｅ）、フェンチオン（ｆｅｎｔｈｉｏｎ：ＭＰＰ）、フエニトロチオン（ｆｅｎｉｔｒｏｔｈｉｏｎ：ＭＥＰ）、マラチオン（ｍａｌａｔｈｉｏｎ）、ピリダフェンチオン（ｐｙｒｉｄａｆｅｎｔｈｉｏｎ）、プロパホス（ｐｒｏｐａｐｈｏｓ）、トリクロルホン（ｔｒｉｃｈｌｏｒｐｈｏｎ：ＤＥＰ）等；
（３）カーバメート系化合物
カルバリル（ｃａｒｂａｒｙ１）、カルボフラン（ｃａｒｂｏｆｕｒａｎ）、フェノブカルブ（ｆｅｎｏｂｕｃａｒｂ）、イソプロカルブ（ｉｓｏｐｒｏｃａｒｂ：ＭＩＰＣ）、メソミル（ｍｅｔｈｏｍｙｌ）、ＮＡＣ、プロポクスル（ｐｒｏｐｏｘｕｒ：ＰＨＣ）等；
（４）ネライストキシン系化合物
カルタップ（ｃａｒｔａｐ）、ベンスルタップ（ｂｅｎｓｕｌｔａｐ）等；
（５）ネオニコチノイド系化合物
イミダクロプリド（ｉｍｉｄａｃｌｏｐｒｉｄ）、ニテンピラム（ｎｉｔｅｎｐｙｒａｍ）、アセタミプリド（ａｃｅｔａｍｉｐｒｉｄ）、チアメトキサム（ｔｈｉａｍｅｔｈｏｘａｍ）、チアクロプリド（ｔｈｉａｃｌｏｐｒｉｄ）、ジノテフラン（ｄｉｎｏｔｅｆｕｒａｎ）、クロチアニジン（ｃｌｏｔｈｉａｎｉｄｉｎ）等；
（６）ベンゾイル尿素系化合物
クロルフルアズロン（ｃｈｌｏｒｆｌｕａｚｕｒｏｎ）、ビストリフルロン（ｂｉｓｔｒｉｆｌｕｒｏｎ）、ジフルベンズロン（ｄｉｆｌｕｂｅｎｚｕｒｏｎ）、フルフェノクスロン（ｆｌｕｆｅｎｏｘｕｒｏｎ）、ヘキサフルムロン（ｈｅｘａｆｌｕｍｕｒｏｎ）、テフルベンズロン（ｔｅｆｌｕｂｅｎｚｕｒｏｎ）、トリフルムロン（ｔｒｉｆｌｕｍｕｒｏｎ）等；
（７）フェニルピラゾール系化合物
フィプロニル（ｆｉｐｒｏｎｉ１）、ピリプロール（ｐｙｒｉｐｒｏｌｅ）、ピラフルプロール（ｐｙｒａｆｌｕｐｒｏｌｅ）等；
（８）ヒドラジン系化合物
クロマフェノジド（ｃｈｒｏｍａｆｅｎｏｚｉｄｅ）、ハロフェノジド（ｈａｌｏｆｅｎｏｚｉｄｅ）、メトキシフェノジド（ｍｅｔｈｏｘｙｆｅｎｏｚｉｄｅ）等；
（９）天然系殺虫剤
マシン油（ｍａｃｈｉｎｅ　ｏｉｌ）、硫酸ニコチン（ｎｉｃｏｔｉｎｅ－ｓｕｌｆａｔｅ）；
（１０）その他の殺虫剤
アベルメクチン（ａｖｅｒｍｅｃｔｉｎ－Ｂ）、ブプロフェジン（ｂｕｐｒｏｆｅｚｉｎ）、クロルフェナピル（ｃｈｌｏｒｐｈｅｎａｐｙｒ）、ハイドロプレン（ｈｙｄｒｏｐｒｅｎｅ）、メトプレン（ｍｅｔｈｏｐｒｅｎｅ）、インドキサカルブ（ｉｎｄｏｘａｃａｒｂ）、メトキサジアゾン（ｍｅｔｏｘａｄｉａｚｏｎｅ）、ミルベマイシンＡ（ｍｉｌｂｅｍｙｃｉｎ－Ａ）、ピリダリル（ｐｙｒｉｄａｌｙｌ）、ピリプロキシフェン（ｐｙｒｉｐｒｏｘｙｆｅｎ）、スピノサッド（ｓｐｉｎｏｓａｄ）、スルフラミド（ｓｕｌｆｌｕｒａｍｉｄ）、トルフェンピラド（ｔｏｌｆｅｎｐｙｒａｄ）、トリアゼメイト（ｔｒｉａｚａｍａｔｅ）、フルベンジアミド（ｆｌｕｂｅｎｄｉａｍｉｄｅ）、臭化メチル（Ｍｅｔｈｙｌ　ｂｒｏｍｉｄｅ）、オレイン酸カリウム（Ｐｏｔａｓｓｉｕｍ　ｏｌｅａｔｅ）等が挙げられる。

【００２９】

忌避剤の有効成分としては、例えばＮ，Ｎ－ジエチル－ｍ－トルアミド、リモネン、リナロール、シトロネラール、メントール、メントン、ヒノキチオール、ゲラニオール、ユー

カリプトール、カラン－３，４－ジオール、ＩＲ－３５３５、ＭＧＫ－Ｒ－３２６、ＭＧＫ－Ｒ－８７４及びＢＡＹ－ＫＢＲ－３０２３が挙げられる。

【００３０】

共力剤の有効成分としては、例えば５－〔２－（２－ブトキシエトキシ）エトキシメチル〕－６－プロピル－１，３－ベンゾジオキソール、Ｎ－（２－エチルヘキシル）ビシクロ［２．２．１］ヘプト－５－エン－２，３－ジカルボキシイミド、オクタクロロジプロピルエーテル、チオシアノ酢酸イソボルニル、Ｎ－（２－エチルヘキシル）－１－イソプロピル－４－メチルビシクロ［２．２．２］オクト－５－エン－２，３－ジカルボキシイミド等が挙げられる。

【００３１】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば有害昆虫や有害ダニ等の有害節足動物が挙げられ、具体的には以下のものが挙げられる。

双翅目害虫：アカイエカ、コガタアカイエカ等のイエカ類、ネッタイシマカ、ヒトスジシマカ等のヤブカ類、シナハマダラカ等のハマダラカ類、ユスリカ類、イエバエ、オオイエバエ、ヒメイエバエ等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、タネバエ、タマネギバエ等のハナバエ類、ミバエ類、ハモグリバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ノミバエ類、アブ類、ブユ類、サシバエ類、ヌカカ類等；

網翅目害虫：チャバネゴキブリ、クロゴキブリ、ワモンゴキブリ、トビイロゴキブリ、コバネゴキブリ等；

膜翅目害虫：アリ類、スズメバチ類、アリガタバチ類、カブラハバチ等のハバチ類等；

隠翅目害虫：イヌノミ、ネコノミ、ヒトノミ等；

シラミ目害虫：ヒトジラミ、ケジラミ、アタマジラミ、コロモジラミ等；

等翅目害虫：ヤマトシロアリ、イエシロアリ等；

半翅目害虫：ヒメトビウンカ、トビイロウンカ等のウンカ類、ツマグロヨコバイ等のヨコバイ類、ワタアブラムシ等のアブラムシ類、カメムシ類、トコジラミ等のトコジラミ類等；

鱗翅目害虫：ニカメイガ、コブノメイガ等のメイガ類、ハスモンヨトウ、アワヨトウ、ヨトウガ等のヨトウ類、シンクイガ類、ハモグリガ類、ドクガ類、コナガ、イチモンジセセリ、イガ、コイガ等；

鞘翅目害虫：ヒメカツオブシムシ、ヒメマルカツオブシムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ、コクヌストモドキ等のゴミムシダマシ類、シバンムシ類、ヒラタキクイムシ類等；

ダニ類：コナヒョウヒダニ、ヤケヒョウヒダニ等のヒョウヒダニ類、ケナガコナダニ、ムギコナダニ等のコナダニ類、チリニクダニ、イエニクダニ、サナアシニクダニ等のニクダニ類、クワガタツメダニ、フトツメダニ等のツメダニ類、ホコリダニ類、マルニクダニ類、イエササラダニ類、フタトゲチマダニ等のマダニ類、トリサシダニ、ワクモ等のワクモ類。

【００３２】

本発明の有害生物の防除方法は、本発明化合物の有効量を、通常本発明の有害生物防除剤の形態にて、有害生物又は有害生物の生息場所に施用することにより行われる。

本発明の有害生物防除剤の施用方法としては、例えば以下の方法が挙げられ、本発明の有害生物防除剤の形態、使用場所等に応じて適宜選択できる。

（１）本発明の有害生物防除剤をそのまま有害生物又は有害生物の生息場所に処理する方法。

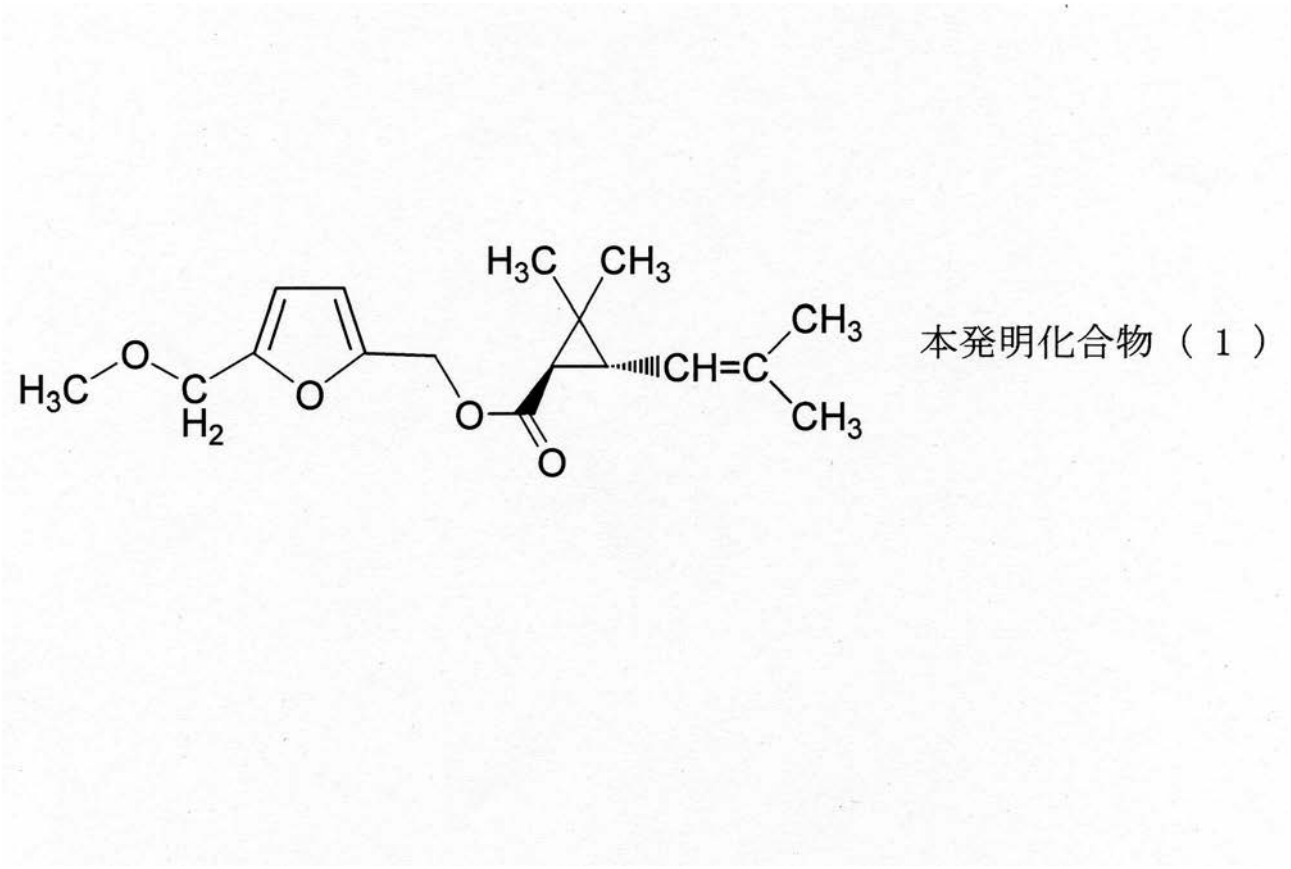
（２）本発明の有害生物防除剤を水等の溶媒で希釈した後に、有害生物又は有害生物の生息場所に散布処理する方法。

この場合には、通常、乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル製剤等に製剤化された本発明の有害生物防除剤を本発明化合物の濃度が０．１～１００００ｐｐｍとなるように希釈する。

（３）本発明の有害生物防除剤を有害生物の生息場所で、加熱等の手段により有効成分を

揮散させる方法。
この場合、本発明化合物の施用量、施用濃度はいずれも本発明の有害生物防除剤の形態、施用時期、施用場所、施用方法、有害生物の種類、被害状況等に応じて適宜定めることができる。
【００３３】
本発明化合物を害虫防除用として用いる場合は、その施用量は空間に適用するときは、本発明化合物の量として通常０．００１～１００ｍｇ／ｍ^{3}であり、平面に適用するときは０．００１～１００ｍｇ／ｍ^{2}である。蚊取線香、蚊取マット等はその製剤形態に応じて加熱により有効成分を揮散させて施用する。樹脂蒸散剤、紙蒸散剤、不織布蒸散剤、編織物蒸散剤、昇華性錠剤等は例えば施用する空間にそのまま放置する、および、該製剤に送風下に設置することにより使用できる。
本発明の有害生物防除組成物を害虫防除用として施用する空間としては、例えば、リビングルーム、食堂、寝室、クローゼット、押入れ、和ダンス、食器棚、トイレ、浴場、物置、倉庫、車内等が挙げられ、さらに野外の開放空間で施用することもできる。
【００３４】
本発明の有害生物防除組成物をウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ニワトリ等の家畜、イヌ、ネコ、ラット、マウス等の小動物の外部寄生虫防除に用いる場合は、獣医学的に公知の方法で動物に使用することができる。具体的な使用方法としては、全身抑制（systemic control）を目的にする場合には、例えば錠剤、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）により投与され、非全身的抑制（non-systemic control）を目的とする場合には、例えば油剤若しくは水性液剤を噴霧する、ポアオン（pour-on）処理若しくはスポットオン（spot-on）処理する、シャンプー製剤で動物を洗う又は樹脂蒸散剤を首輪や耳札にして動物に付ける等の方法により用いられる。動物体に投与する場合の本発明化合物の量は、通常動物の体重１ｋｇに対して、０．０１～１００ｍｇの範囲である。
【実施例】
【００３５】
以下、製造例、参考製造例、製剤例及び試験例等により本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。
【００３６】
まず、本発明化合物の製造例を示す。
【００３７】
製造例１
５－メトキシメチル－２－フランメタノール（２１３ｍｇ，１．５０ｍｍｏｌ）及び（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ン酸（２５２ｍｇ，１．５０ｍｍｏｌ）のクロロホルム溶液（５ｍＬ）に１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド　ハイドロクロライド（３０６ｍｇ、１．６ｍｍｏｌ）及び４－ジメチルアミノピリジン(２０ｍｇ)を加えた。室温で１２時間攪拌した後、反応液に水を注加し、これを酢酸エチルで抽出した。該有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧条件下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下記式［化５］

【化５】



本発明化合物（１）

で示される５－メトキシメチル－２－フリルメチル＝（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（以下、本発明化合物（１）と記す。）２９５ｍｇを得た。

【００３８】

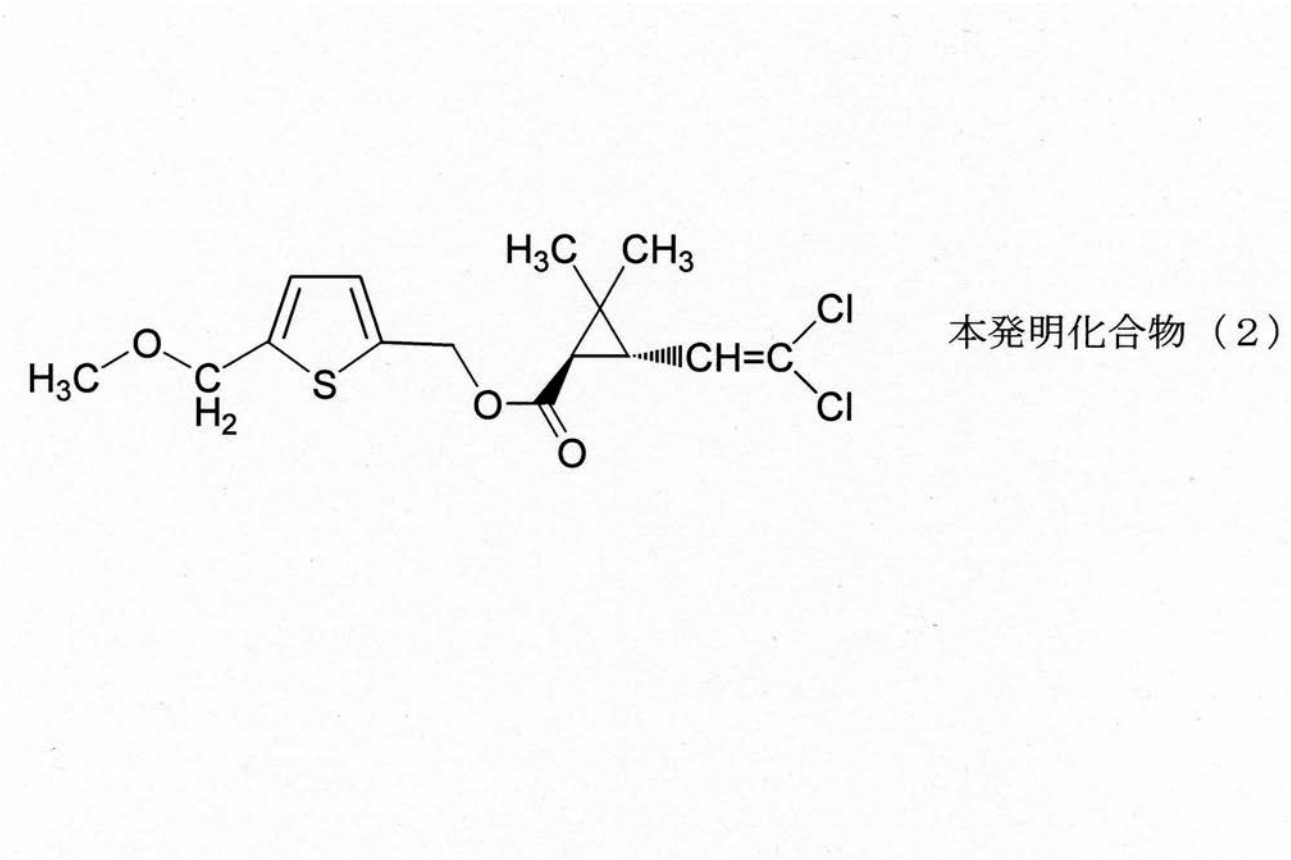
無色液体：^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_{3}$，ＴＭＳ）δ（ｐｐｍ）：１．１２（ｓ，３Ｈ）、１．２２（ｓ，３Ｈ）、１．３８（ｄ，１Ｈ）、１．７２（ｍ、６Ｈ）、２．０７（ｄｄ，１Ｈ）、３．３８（ｓ，３Ｈ）、４．３９（ｓ，２Ｈ）、４．８７（ｄｍ，１Ｈ）、５．０３（ｄｄ，２Ｈ）、６．３０（ｄ，１Ｈ）、６．３６（ｄ，１Ｈ）

【００３９】

製造例２

５－メトキシメチル－２－チオフェンメタノール（２３７ｍｇ，１．５０ｍｍｏｌ）をトルエン（３ｍＬ）に溶かし、ピリジン０．１５ｍＬを加えた。ここに氷冷下で、（１Ｒ）－トランス－３－（２，２－ジクロロエテニル）－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボン酸クロリド（３４１ｍｇ，１．５０ｍｍｏｌ）のトルエン溶液（１ｍＬ）を加えた。室温で１２時間攪拌した後、反応液に水を注加し、これを酢酸エチルで抽出した。該有機層を５％塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧条件下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下記式［化６］

【化６】



で示される５－メトキシメチル－２－テニルメチル＝（１Ｒ）－トランス－３－（２，２－ジクロロエテニル）－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボキシレート（以下、本発明化合物（２）と記す。）４０１ｍｇを得た。

【００４０】

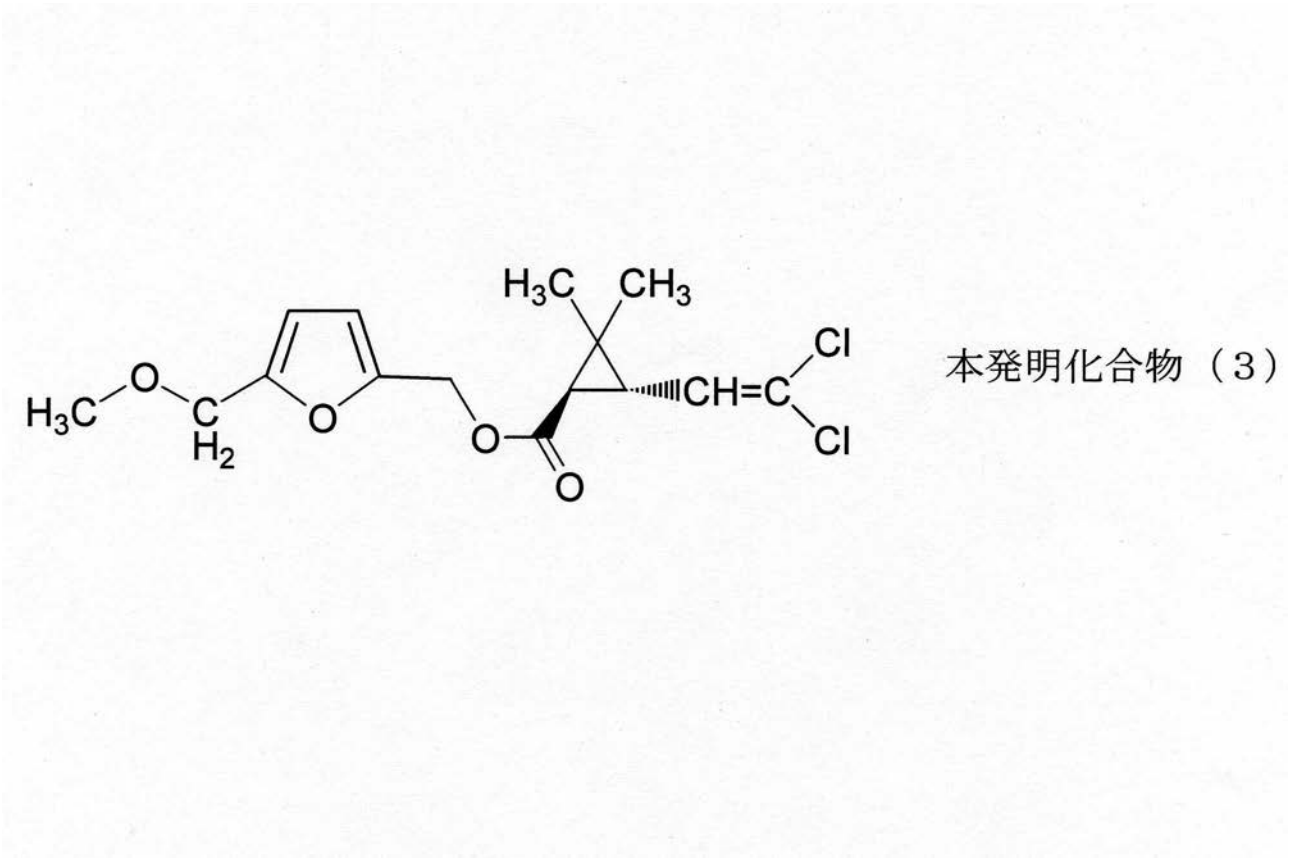
淡黄色液体：^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_{3}$，ＴＭＳ）δ（ｐｐｍ）：１．１８（ｓ，３Ｈ）、１．２０（ｓ，３Ｈ）、１．６２（ｄ，１Ｈ）、２．２６（ｄｄ，１Ｈ）、３．３７（ｓ，３Ｈ）、４．５７（ｓ，２Ｈ）、５．２３（ｄｄ，２Ｈ）、５．５９（ｄ、１Ｈ）、６．８７（ｄ，１Ｈ）、６．９５（ｄ，１Ｈ）

【００４１】

製造例３

製造例２において、５－メトキシメチル－２－チオフェンメタノールの代わりに、５－メトキシメチル－２－フランメタノールを用いて同様に操作を行い、下記式［化７］

【化７】



で示される５－メトキシメチル－２－フリルメチル＝（１Ｒ）－トランス－３－（２，２－ジクロロエテニル）－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボキシレート（以下、本発明化合物（３）と記す。）を得た。

【００４２】

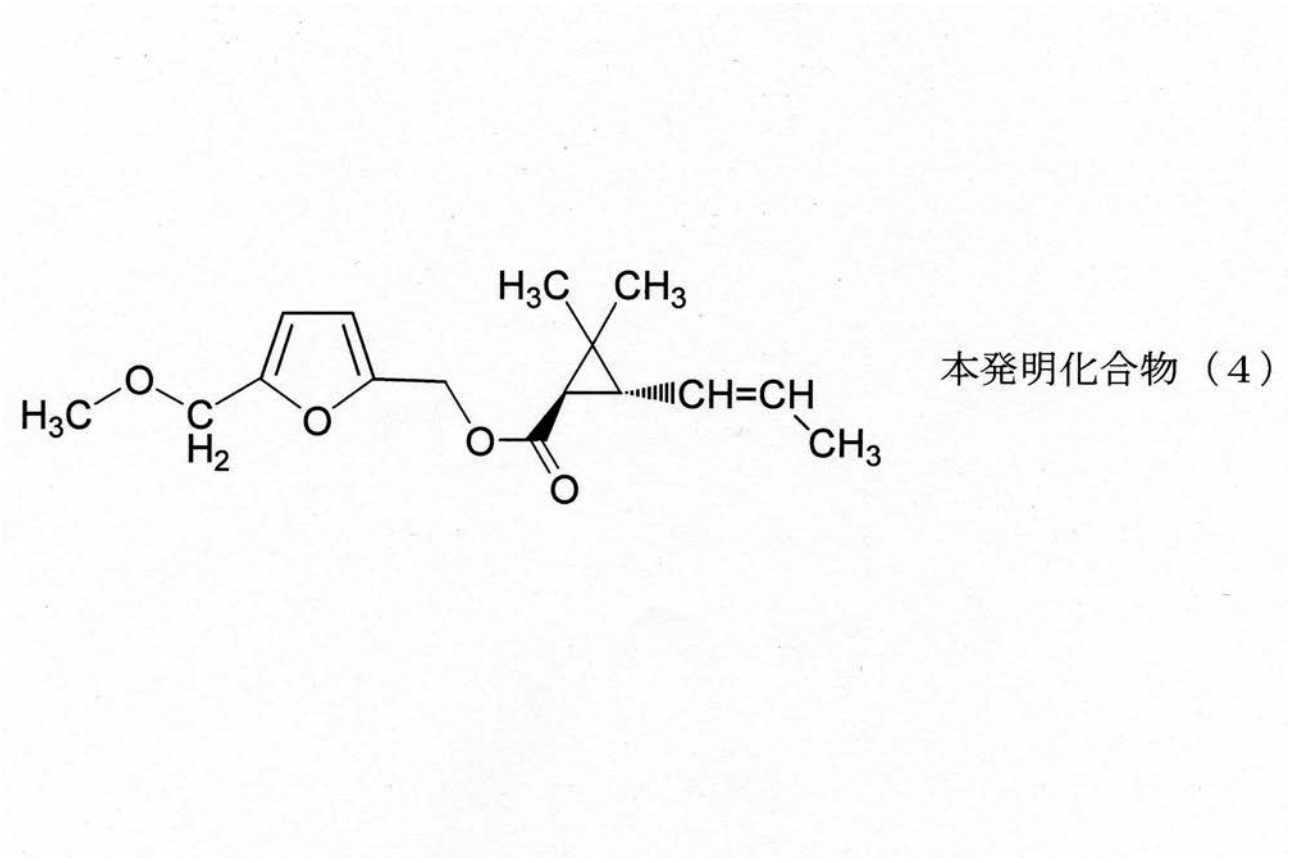
無色液体：^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_{3}$，ＴＭＳ）δ（ｐｐｍ）：１．１８（ｓ，３Ｈ）、１．２７（ｓ，３Ｈ）、１．６３（ｄ，１Ｈ）、２．２５（ｄｄ，１Ｈ）、３．３８（ｓ，３Ｈ）、４．３９（ｓ，２Ｈ）、５．０６（ｄｄ，２Ｈ）、５．５８（ｄ、１Ｈ）、６．３０（ｄ，１Ｈ）、６．３６（ｄ，１Ｈ）

【００４３】

製造例４

製造例１において、（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ン酸の代わりに、（１Ｒ）－トランス－３－［(１Ｚ)－１－プロペニル］－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボン酸を用いて、同様に操作を行って、下記式［化８］

【化８】



で示される５－メトキシメチル－２－フリルメチル＝（１Ｒ）－トランス－３－［(１Ｚ)－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（以下、本発明化合物（４）と記す。）を得た。

【００４４】

無色液体：^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_{3}$，ＴＭＳ）δ（ｐｐｍ）：１．１３（ｓ，３Ｈ）、１．２７（ｓ，３Ｈ）、１．４９（ｄ，１Ｈ）、１．７０（ｄｍ，３Ｈ）、２．１６（ｄｄ，１Ｈ）、３．３８（ｓ，３Ｈ）、４．３９（ｓ，２Ｈ）、５．０２（ｄｄ，２Ｈ）、５．１１（ｍ、１Ｈ）、５．５７（ｍ、１Ｈ）、６．３０（ｄ，１Ｈ）、６．３６（ｄ，１Ｈ）

【００４５】

次に、製剤例を示す。なお、部は質量部を示す。

【００４６】

製剤例１

本発明化合物（１）～（４）の各々０．１部をキシレン １０部に溶解し、これを脱臭灯油
８９．９部に混合して、油剤を得る。

【００４７】

製剤例２

本発明化合物（１）～（４）の各々０．１部及び脱臭灯油 ３９．９部を混合溶解したものをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス） ６０部を加圧充填して、油性エアゾールを得る。

【００４８】

製剤例３

本発明化合物（１）～（４）の各々０．６部、キシレン ５部、脱臭灯油 ３．４部及びレ

オドールＭＯ－６０　（乳化剤、花王株式会社登録商標）　１部を混合溶解したものと、水
５０部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）　４０部を加圧充填して、水性エアゾールを得る。

【００４９】

製剤例４

本発明化合物（１）～（４）の各々０．３ｇ及びＢＨＴ０．５ｇを、蚊取線香用基材（除虫菊抽出粕粉、木粉、タブ粉、及び澱粉を混合したもの）　９９．２ｇに均一に攪拌混合した後、着色剤としてマラカイトグリーンを含む水　１００ｍＬを加え、十分混練したものを成型乾燥し、蚊取線香を得る。

【００５０】

製剤例５

本発明化合物（１）～（４）の各々０．８ｇ、ピペロニルブトキシド　０．４ｇ、及び染料に脱臭灯油を加えて溶解し、全部で１０ｍＬとする。この溶液　０．５ｍＬを２２ｍｍ×３５ｍｍ、厚さ２．８ｍｍの蚊取マット用基材（コットンリンターとパルプの混合物のフィリブルを板状に固めたもの）に均一に含浸させて、蚊取マット剤を得る。

【００５１】

製剤例６

本発明化合物（１）～（４）の各々０．７部及びＢＨＴ０．３部を、界面活性剤（ジエチレングリコールモノブチルエーテル）５０部と精製水４９部に溶解して得られる液剤をポリエステル製容器に入れ、上部をヒーターで加熱できるようにした吸液芯（無機粉体を焼成したもの）を挿入することにより、加熱蒸散装置に用いる水性蚊取リキッド剤を得る。

【００５２】

製剤例７

本発明化合物（１）～（４）の各々１００ｍｇを適量のアセトンに溶解し、４ｃｍ×４ｃｍ、厚さ１．２ｃｍの多孔セラミック板に含浸させて、加熱燻煙剤を得る。

【００５３】

製剤例８

本発明化合物（１）～（４）の各々１０ｍｇを適量のアセトンに溶解し、５ｃｍ×５ｃｍ、厚さ０．３ｍｍの不織布に均一に塗布した後、アセトンを風乾して、常温揮散剤を得る。

【００５４】

製剤例９

本発明化合物（１）～（４）の各々１０部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩５０部を含むホワイトカーボン３５部、及び水５５部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕することにより、１０％フロアブル剤を得る。

【００５５】

次に、本発明化合物が有害生物防除剤の有効成分として有効であることを試験例として示す。

【００５６】

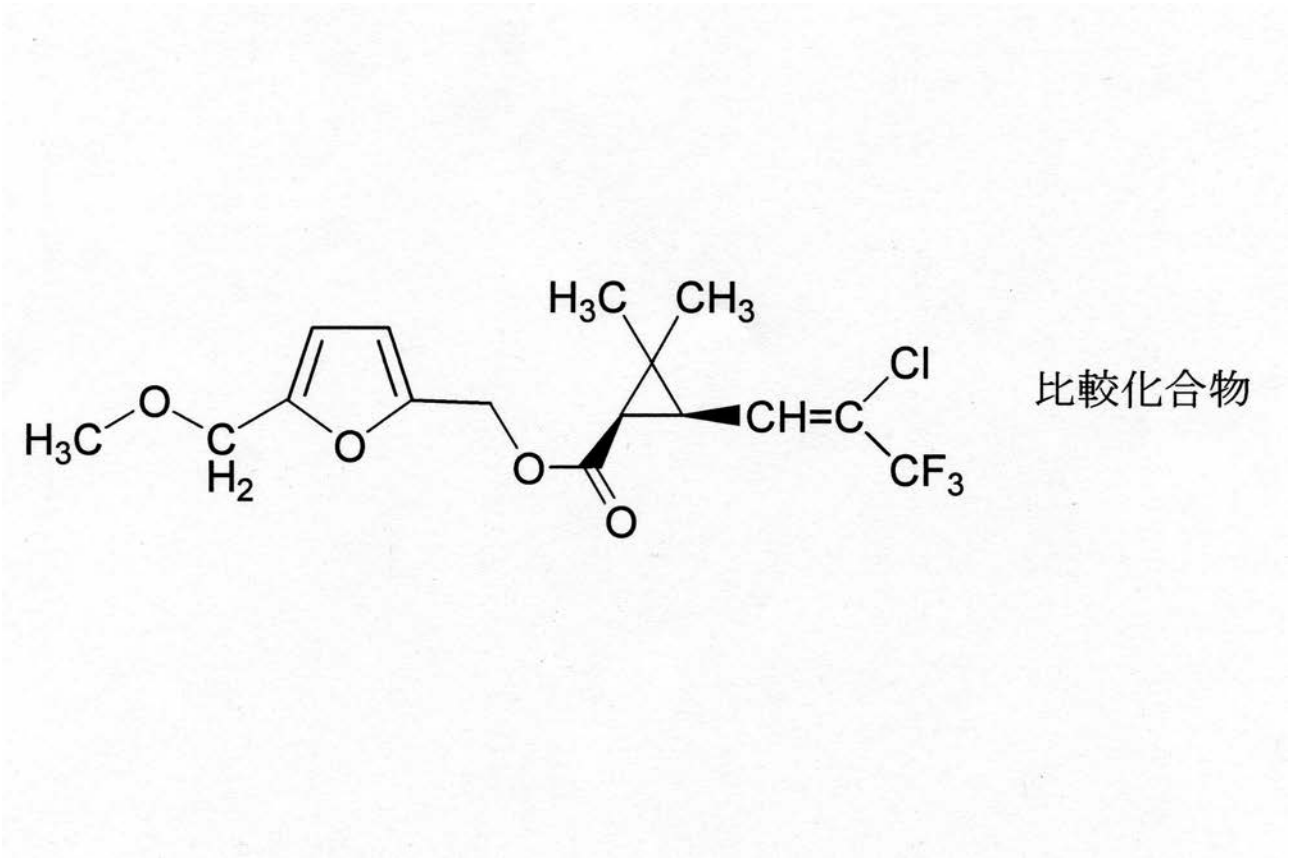
試験例１

供試化合物０．３ｇと蚊取線香用基材（除虫菊抽出粕粉、木粉、タブ粉、及び澱粉を混合したもの）　９９．７ｇに均一に攪拌混合した後、水　１００ｍＬを加え、十分混練したものを成型乾燥し、蚊取線香を調製した。

アカイエカ成虫２０頭（雌）を入れた密閉された円筒（直径２０ｃｍ、高さ４３ｃｍ）内の下部で、上記に従って調製した線香（本発明化合物、比較化合物およびアレスリン）を１分間燃やし１５分間暴露させた。暴露から一定時間後（５分後）にノックダウンした虫数をカウントした（２反復平均）。

また、比較対照として下記式［化９］

【化９】



で示される５－メトキシメチル－２－フリルメチル＝（１Ｒ）－シス－３－（２－クロル－３，３，３－トリフルオロ－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（特開平６－２５２０５号公報に記載の化合物。以下、比較化合物と記す。）およびアレスリン：（ＲＳ）－２－メチル－３－（２－プロペニル）－シクロペント－２－エン－４－オン－１－イル＝（１ＲＳ）－トランス、シス－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、同様に試験を行った。
結果を表１に示す。
【００５７】

【表１】

供試化合物	５分後のノックダウン%
本発明化合物（１）	９５
本発明化合物（２）	９０
本発明化合物（３）	９５
本発明化合物（４）	９０
比較化合物	６５
アレスリン	５０

【００５８】
試験例２
直径２８ｍｍ、内高１３ｍｍ、底面積６．１５ｃｍ^{2}であるシャーレに本発明化合物（１）、（３）、およびペルメトリン［３－フェノキシベンジル＝（１ＲＳ）－トランス、シス－３－（２、２－ジクロルエテニル）－２，２－ジメチルシクロプロパンカルボキシレート］０．１ｍｇを含む０．２％アセトン溶液０．０５ｍＬを滴下し、底面に均一になるよう拡げた後、２連球でアセトンを除去する。各試料が底面に保持されたシャーレに、アカイエカの雌３匹を入れ、穴あきフィルムで上側をカバーした後、５分毎にノックダウン数を記録し、KT_{100}（１００％ノックダウンする時間）と２４時間後の致死率を測定しかつ記録する。ノックダウン率につき所定以上の数値を示す試料については、前記０．２％アセトン溶液に更にアセトンを加えて１０倍に希釈し、０．０２％アセトン溶液とし、前記の各器具（シャーレ）、試験方法を順次繰り返した。
以下、同様に処理し、各化合物として０．００１ｍｇまで希釈した試料の効力を表２に示す。
【００５９】

【表２】

本発明化合物及び比較化合物	各化合物の容器中の重量 (mg/6.15cm^2)	ＫＴ100値（分）	24時間後の致死率（%）
本発明化合物（１）	0.001	＜5	100
本発明化合物（３）	0.001	＜5	100
ペルメトリン	0.001	25	100

【産業上の利用可能性】

【００６０】

本発明化合物は優れた有害生物防除効力を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

フロントページの続き

Ｆターム(参考) 4H011 AC01 AC02 AC04 BA01 BB15 BC01 BC03 BC07 BC22 DA10
DA16 DA21 DB05 DC05 DD05