(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号
特許第3692573号
(P3692573)
(45)発行日　平成17年9月7日(2005.9.7)　(24)登録日　平成17年7月1日(2005.7.1)

(51)Int.Cl.[7]　F I
A01N 47/04　A01N 47/04

請求項の数 4　(全 14 頁)

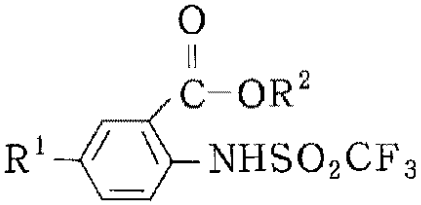
(21)出願番号　特願平7-274161
(22)出願日　平成7年10月23日(1995.10.23)
(65)公開番号　特開平8-319202
(43)公開日　平成8年12月3日(1996.12.3)
審査請求日　平成14年8月23日(2002.8.23)
(31)優先権主張番号　特願平7-60871
(32)優先日　平成7年3月20日(1995.3.20)
(33)優先権主張国　日本国(JP)

(73)特許権者　000002093
住友化学株式会社
東京都中央区新川二丁目２７番１号
(74)代理人　100093285
弁理士　久保山　隆
(72)発明者　森　達哉
兵庫県宝塚市高司４丁目２番１号　住友化学工業株式会社内
(72)発明者　渡辺　敬介
兵庫県宝塚市高司４丁目２番１号　住友化学工業株式会社内
(72)発明者　三木谷　研一
兵庫県宝塚市高司４丁目２番１号　住友化学工業株式会社内

最終頁に続く

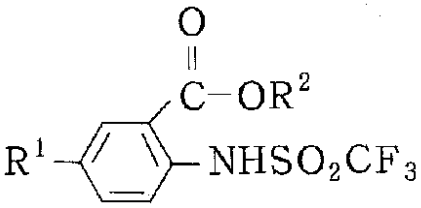
(54)【発明の名称】ツメダニ類防除剤

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
一般式　化１
【化１】

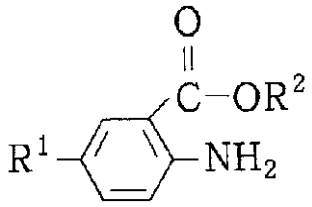


〔式中、R^1はハロゲン原子を表わし、R^2はC_1～C_4アルキル基を表わす。〕
で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物を有効成分として含有することを特徴とするツメダニ類防除剤。
【請求項２】
R^1 が塩素原子である請求項１記載のツメダニ類防除剤。
【請求項３】
R^1 が塩素原子であり、R^2 がメチル基である請求項１記載のツメダニ類防除剤。
【請求項４】
請求項１記載の一般式　化１で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物を有効成分として含有することを特徴とするツメダニ類防除のためのシート。

【発明の詳細な説明】
【０００１】
【発明の属する技術分野】
本発明はツメダニ類防除剤に関する。
【従来の技術および発明が解決しようとする課題】
近年、室内に生息するダニ類による被害が注目を集めているが、中でもツメダニ類はしばしば人を刺して虫咬症を引き起こすことから、ツメダニ類の有効な防除剤が望まれていた。
従来より、室内に生息するダニ類を防除するため、ある種の有機リン剤やピレスロイド剤等が使用されているが、これらの薬剤もツメダニ類の防除効力等の点で必ずしも常に充分とは言いがたい。
【０００２】
【課題を解決するための手段】
本発明者らは、このような状況下、優れたツメダニ類防除剤を開発すべく鋭意検討した結果、　一般式　化２
【化２】

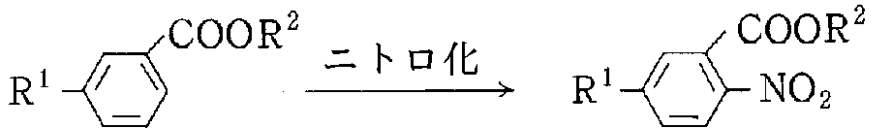


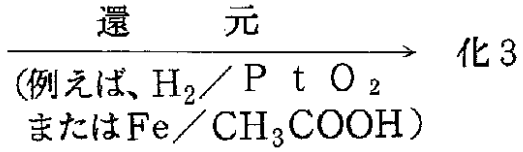
〔式中、R^1 はハロゲン原子（塩素原子、臭素原子等）を表わし、R^2 はC_1 ～C_4 アルキル基（メチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、ｎ－ブチル基、イソプロピル基、イソブチル基、ｓｅｃ－ブチル基またはtert－ブチル基）を表わす。〕
で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物が、ツメダニ類に対し極めて優れた防除効果を有すると共に、哺乳動物に対する安全性の点でも優れていることを見出し、本発明を完成した。
すなわち、本発明は一般式　化２で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物を有効成分とするツメダニ類防除剤を提供するものである。
【０００３】
【発明の実施の形態】
本発明におけるツメダニ類とは、ツメダニ科に属するダニを意味し、かかるツメダニ類としてはミナミツメダニ、クワガタツメダニ、フトツメダニ、ホソツメダニ、タタミツメダニ、ツヨツメダニ、マメタンツメダニ、アシナガツメダニ等があげられる。
一般式　化２で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物は、ツメダニ類防除において、速効性、残効性や燻煙効果に優れ、しかも、該化合物には哺乳動物に対し問題となるような急性毒性、目刺激性、皮膚刺激性、皮膚感作性等の毒性や問題となるような臭気もなく、本発明の防除剤は室内においても安心して用いることができる。
一般式　化２で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物においてツメダニ類防除効力等の点から、R^1 としては塩素原子が好ましく、R^2 としてはメチル基が好ましい。
【０００４】
一般式　化２で示されるトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物は、例えば以下の方法により製造することができる。
一般式　化３
【化３】



〔式中、R^1 およびR^2 は前記と同じ意味を表わす。〕
で示されるアニリン化合物とトリフルオロメタンスルホン酸無水物またはトリフルオロメタンスルホン酸ハライド（クロライド、フルオライド等）とを塩基の存在下に反応させることにより製造する方法。
本反応は通常溶媒中で行い、使用される溶媒としては、例えば、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ｎ－ヘキサン、ｎ－ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族または脂環式炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、１，２－ジクロルエタン、クロルベンゼン等のハロゲン化炭化水素類等、またはそれらの混合溶媒等があげられる。
使用される塩基としては、例えば、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化アルカリ類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸アルカリ類等があげられる。
反応温度は、通常－２０℃から反応に使用する溶媒の沸点の範囲または１００℃をとることができる。
反応に供する原料および塩基のモル比は任意に設定できるが、等モルまたはそれに近い比率で反応を行うのが有利である。
反応終了後の反応液は、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理を行い、目的の一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物を単離することができる。必要ならば、クロマトグラフィー、再結晶、蒸留等の通常の操作によってさらに精製することもできる。

【０００５】
一般式　化３で示されるアニリン化合物は、市販されているものを用いるか、または、例えば、下記製造ルート　化４にしたがって得ることができる。
【化４】





〔式中、R^1 およびR^2 は前記と同じ意味を表わす。〕

【０００６】
本発明の防除剤において、有効成分は他の何らの成分も加えずそのまま使用してもよいが、通常は、固体担体、液体担体、ガス状担体、餌等と混合するか、あるいは多孔セラミックス板や不織布等の基材に含浸し、必要あれば界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、水和剤、フロアブル剤、粉剤、エアゾール、燻煙剤、燻霧剤（フォッギング等）、毒餌、防ダニシート等に製剤して使用する。これらの製剤には、有効成分として一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物を重量比で通常0.01～９

５％含有する。
製剤化の際に用いられる固体担体としては、たとえば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、合成含水酸化珪素、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）等の微粉末あるいは粒状物等があげられ、液体担体としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール類）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等）、酸アミド類（Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、ジメチルスルホキシド、大豆油、綿実油等の植物油等があげられ、ガス状担体、すなわち噴霧剤としては、たとえばフロンガス、ブタンガス、ＬＰＧ（液化石油ガス）、ジメチルエーテル、炭酸ガス等があげられる。
界面活性剤としては、たと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およびそ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、糖アルコール誘導体等があげられる。
固着剤や分散剤等の製剤用補助剤としては、たとえばカゼイン、ゼラチン、多糖類（でんぷん粉、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、ポリアクリル酸類等）等があげられ、安定剤としては、たとえばＰＡＰ（酸性リン酸イソプロピル）、ＢＨＴ（２，６－ジ－tert－ブチル－４－メチルフェノール）、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）、植物油、鉱物油、界面活性剤、脂肪酸またはそのエステル等があげられる。
毒餌の基材としては、たとえば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、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、トウガラシ末等の誤植防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の誘引性香料等があげられる。

【０００７】

このようにして得られる製剤は、そのままであるいは水等で希釈して用いる。また、他の殺ダニ剤、殺虫剤、殺虫殺ダニ剤、殺微生物剤、共力剤、動物用飼料等と混合して、または混合せずに同時に用いることもできる。このような他の殺ダニ剤、殺虫剤または殺虫殺ダニ剤としては、サリチル酸フェニル、ｄ－フェノスリン、テトラメスリン、ｄ－アレスリン、パーメスリン、レスメスリン、フタルスリン、エムペンスリン、プラレスリン、フェニトロチオン、ジクロルボス、メトキサジアゾン、フィプロニル、安息香酸ベンジル、イソボルニルチオシアノアセテート、パラオキシ安息香酸エステル、ヨウ素化ホルマール、フェノール類、フタル酸エステル、３－ブロモ－２，３－ヨード－２－プロペニル－エチルカーボネート、モノテルペン系エポキサイド類、等があげられる。

【０００８】

本発明の防除剤の使用において、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は、通常、水にて有効成分量で0.１ppm ～５００ppm に希釈して施用し、油剤、粒剤、粉剤、燻蒸剤、燻煙剤、エアゾール、燻霧剤、毒餌、防ダニシート等についてはそのまま施用する。その際の施用量は、有効成分量として、処理すべき面積１m^2 当たり通常１０～１０００ｍｇ、または、適用空間１m^3 当たり通常１～１０００ｍｇである。
これらの施用量、施用濃度は、いずれも製剤の種類、施用時期、施用場所、施用方法、被害程度等の状況によって異なり、上記の範囲にかかわることなく増加させたり、減少させたりすることができる。
本発明の防除剤は、通常、畳、カーペット、マットレス、ソファー、布団、枕等の寝具、押入、倉庫等に、散布、噴霧、塗布、煙霧、加熱蒸散、設置等の方法により処理して用い

る。

【０００９】

【実施例】

以下、本発明を製剤例や試験例等により、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。

まず、一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物の製造例を示す。

参考製造例　〔化合物（１）の製造〕

５－クロロ－２－アミノ安息香酸メチル3.８ｇ、トリエチルアミン2.１ｇおよび乾燥クロロホルム５０mlの混合物中へ、トリフルオロメタンスルホン酸無水物5.８ｇを氷冷下攪拌しつつ滴下した。滴下終了後、室温にてさらに３時間攪拌した後、反応液を氷水に注加し、クロロホルム層を分取した。水層をクロロホルムで１回抽出し、先のクロロホルム層と合せ、水および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下に留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、２－メトキシカルボニル－４－クロロ－トリフルオロメタンスルホンアニリド〔別名１，１，１－トリフルオロ－Ｎ－｛４－クロロ－２－（メトキシカルボニル）フェニル｝メタンスルホンアミド〕4.８ｇを得た。

収率　７５％

ｍｐ　80.7℃

【００１０】

次に、一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物のいくつかを化合物番号および物性値と共に表１に示す。（一般式　化２で示される化合物の置換基の定義で示す。）

【表１】

一般式　化２で示される化合物

化合物番号	R^1	R^2	物性値
(1)	Cl	CH_3	mp 80.7℃
(2)	Cl	CH_2CH_3	mp 65.7℃
(3)	Cl	$CH(CH_3)_2$	mp 41.9℃
(4)	Cl	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	$n_D^{24.0}$ 1.4932
(5)	Cl	$C(CH_3)_3$	mp 87.6℃
(6)	Br	CH_3	mp 73.8℃
(7)	I	CH_3	mp 61.2℃
(8)	Br	CH_2CH_3	mp 62.2℃
(9)	Cl	$CH_2CH_2CH_3$	$n_D^{25.5}$ 1.4898

【００１１】

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表わし、一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物は表１に記載の番号で表わす。

製剤例１　乳剤

化合物（１）～（９）の各々１０部を、キシレン３５部およびジメチルホルムアミド３５部に溶解し、これにポリオキエチレンスチリルフェニルエーテル１４部およびドデシルベ

ンゼンスルホン酸カルシウム６部を加え、よく攪拌混合して各々の１０％乳剤を得る。
製剤例２　水和剤
化合物（１）～（９）の各々２０部を、ラウリル硫酸ナトリウム４部、リグニンスルホン酸カルシウム２部、合成含水酸化珪素微粉末２０部及び珪素土５４部を混合した中に加え、ジュースミキサーで攪拌混合して各々の２０％水和剤を得る。
製剤例３　粉剤
化合物（１）～（９）の各々１部を適当量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末５部、ＰＡＰ0.３部およびクレー93.7部を加え、ジュースミキサーで攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の１％粉剤を得る。
製剤例４　フロアブル剤
化合物（１）～（９）の各々２０部とソルビタントリオレエート1.５部とを、ポリビニルアルコール２部を含む水溶液28.5部と混合し、必要に応じサンドグラインダーで微粉化（粒径３μ以下）した後、この中に、キサンタンガム0.05部およびアルミニウムマグネシウムシリケート0.１部を含む水溶液４０部を加え、さらにプロピレングリコール１０部を加えて攪拌混合して各々の２０％水中懸濁剤を得る。
製剤例５　油剤
化合物（１）～（９）の各々0.１部をキシレン５部およびトリクロロエタン５部に溶解し、これを脱臭灯油89.9部に混合して各々の0.１％油剤を得る。
【００１２】
製剤例６　油性エアゾール
化合物（１）～（９）の各々0.１部、ｄ－フェノスリン0.１部、トリクロロエタン１０部および脱臭灯油59.8部を混合溶解し、エアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）３０部を加圧充填して各々の油性エアゾールを得る。
製剤例７　油性エアゾール
化合物（１）～（９）の各々0.１部、テトラメスリン0.２部、ｄ－フェノスリン0.１部、トリクロロエタン１０部および脱臭灯油59.6部を混合溶解し、エアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）３０部を加圧充填して各々の油性エアゾールを得る。
製剤例８　油性エアゾール
化合物（１）～（９）の各々１部、ケロシン７部および脱臭灯油３２部を混合溶解し、エアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付けた後、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）６０部を加圧充填して各々の油性エアゾールを得る。
製剤例９　水性エアゾール
化合物（１）～（９）の各々0.２部、ｄ－フェノスリン0.２部、キシレン５部、脱臭灯油3.６部および乳化剤｛アトモス３００（アトラスケミカル社登録商標名）｝１部を混合溶解したものと、純水５０部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付け、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）４０部を加圧充填して各々の水性エアゾールを得る。
製剤例１０　水性エアゾール
化合物（１）～（９）の各々0.２部、ｄ－アレスリン0.２部、ｄ－フェノスリン0.２部、キシレン５部、脱臭灯油3.４部および乳化剤｛アトモス３００（アトラスケミカル社登録商標名）｝１部を混合溶解したものと、純水５０部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付け、該バルブ部分を通じて噴射剤（液化石油ガス）４０部を加圧充填して各々の水性エアゾールを得る。
製剤例１１　加熱燻煙剤
化合物（１）～（９）の各々１００mgを適量のアセトンに溶解し、4.０cm×4.０cm、厚さ1.２cmの多孔セラミック板に含浸させて各々の加熱燻煙剤を得る。
製剤例１２　加熱燻煙剤
化合物（１）～（９）の各々５０mgおよびサリチル酸フェニル５０mgを適量のアセトンに

溶解し、4.0cm×4.0cm、厚さ1.2cmの多孔セラミック板に含浸させて各々の加熱燻煙剤を得る。

製剤例１３　毒餌

化合物（１）～（９）の各々１０mgをアセトン0.5mlに溶解し、この溶液を、動物用固型飼料粉末（飼育繁殖用固型飼料粉末ＣＥ－２、日本クレア株式会社商品名）５ｇに処理し、均一に混合する。ついでアセトンを風乾し、各々の0.2％毒餌を得る。

製剤例１４　防ダニシート

化合物（１）～（９）の各々をアセトンで希釈し、不織布に１m^2 当り有効成分量で１ｇとなるように滴下含浸し、アセトンを風乾して各々の防ダニシートを得る。

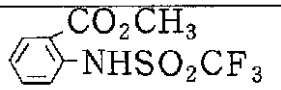
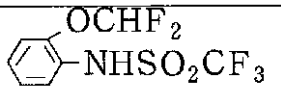
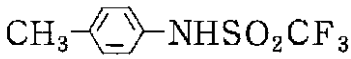
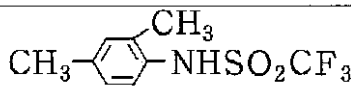
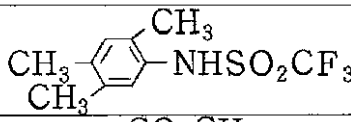
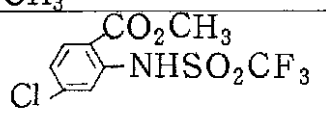
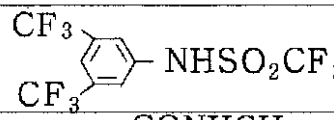
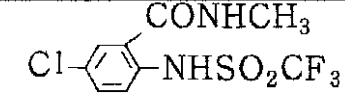
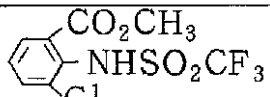
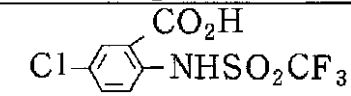
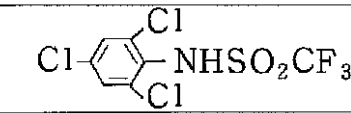
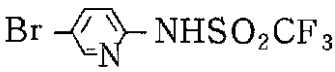
製剤例１５　防ダニシート

化合物（１）～（９）の各々をアセトンで希釈し、ろ紙に１m^2 当り有効成分量で１ｇとなるように滴下含浸し、アセトンを風乾して各々の防ダニシートを得る。

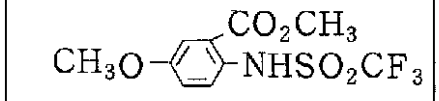
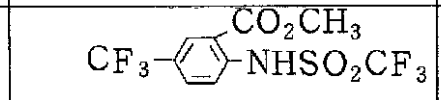
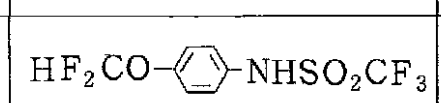
【００１３】

次に、一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物がツメダニ類等の防除剤の有効成分として有用であることを試験例により示す。なお、一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物は表１の化合物番号で示し、比較対照に用いた化合物は表２の化合物記号で示す。

【表２】

化合物記号	化学構造式	備考
A		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （1）
B		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （6）
C		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （7）
D		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （11）
E		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （20）
F		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （25）
G		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （30）
H		特開昭57－156407号公報に記載の化合物 （31）
I		参考比較化合物
J		特開昭57－156407号公報に記載の特許請求の範囲に含まれる化合物
K		参考比較化合物
L		特開昭57－156407号公報に記載の特許請求の範囲に含まれる化合物
M		参考比較化合物
N		参考比較化合物

（表２の続き）

化合物記号	化学構造式	備考
O		特開昭57－156407号公報に記載の特許請求の範囲に含まれる化合物
P		特開昭57－156407号公報に記載の特許請求の範囲に含まれる化合物
Q		特開昭57－156407号公報に記載の化合物（34）

【００１４】
試験例１
直径４cmのろ紙に供試化合物のアセトン溶液を有効成分量で0.08ｇ／m^2 となるように均一に処理し、風乾した。ろ紙表面にミナミツメダニを約２０頭放飼し、７日後に死虫率を観察した。なお、ろ紙の縁にはダニの逃亡を防止するために、粘着物質を塗布した。
結果を表３に示す。
【表３】

化合物	死虫率（%）
(1)	100
(2)	100
(3)	100
(4)	83
(5)	100
(6)	100
(7)	100
(8)	100
(9)	80
A	0
B	0
C	0
D	0
E	0
F	0
G	0
H	0
I	0
J	0
K	0
L	0
M	0
N	0

（表３の続き）

化合物	死虫率（%）
O	0
P	0
Q	0
無処理	0

【００１５】
試験例２
直径４cmのろ紙をアルミ皿上におき、ろ紙の縁にダニの逃亡を防止するための粘着物質を塗布した後、ミナミツメダニを約２０頭、ろ紙上に放飼した。これを３つ準備し、それをピートグラディチャンバー（1.８m×1.８m×1.８m）内の床面の３隅（ピートグラディチャンバーの壁面から約３０cmの所）に各々設置した。ピートグラディチャンバー床面中央においた電熱器により、１７５℃の温度で薬剤のアセトン溶液を含浸させた４cm×４cm×1.２cmの多孔セラミック板（薬量は５５mg／m^3 となるようにした）を２時間（スイッチを入れてからの時間）加熱した。
７日後に死虫率を観察した。結果を表４に示す。
【表４】

化合物	死虫率（%）
(1)	８８
無処理	8

【００１６】
試験例３
直径４cmのろ紙に供試化合物のアセトン溶液を有効成分量で0.08ｇ／m^2 になるように均一に処理し、風乾した。ろ紙表面にケナガコナダニ（コナダニ類の１種）またはコナヒョウダニ（ヒョウヒダニ類の１種）を約２０頭放飼し、１日後に死虫率を観察した。なおろ紙の縁にはダニの逃亡を防止するために粘着物質を塗布した。
コナヒョウダニに対する結果を表５に、ケナガコナダニに対する結果を表６に各々示す。
【表５】

化合物	死虫率（%）
(1)	１００
(2)	１００
(3)	１００
(4)	１００
(5)	１００
(6)	１００
(7)	１００
(8)	１００
(9)	１００
無処理	0

【表６】

化合物	死虫率（%）
(1)	１００
(2)	１００
(3)	１００
(4)	１００
(5)	１００
(6)	１００
(7)	１００
(8)	１００
(9)	１００
無処理	0

【００１７】

試験例４

直径４cmのろ紙に供試化合物のアセトン溶液を有効成分量で0.08ｇ／m^2 になるように均一に処理し、これを２００mlのバイアル瓶のふたの内側に設置した。バイアル瓶の中にネコノミを約２０頭放した後、前述のふたをとりつけ、ろ紙にノミが接触するように瓶を逆

さまの状態にて放置した。２４時間後に死虫率を観察した。結果を表７に示す。
【表７】

化合物	死虫率（%）
（1）	１００
無処理	9

【００１８】
【発明の効果】
一般式　化２のトリフルオロメタンスルホンアニリド化合物はツメダニ類に対して優れた殺ダニ効力を有する。

フロントページの続き

(72)発明者　高田　容司
兵庫県宝塚市高司４丁目２番１号　住友化学工業株式会社内

審査官　吉住　和之

(56)参考文献　特開昭５７－１５６４０７（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl.[7]，ＤＢ名)
CA(STN)
REGISTRY(STN)
A01N 47/04