

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5320460号  
(P5320460)

(45) 発行日 平成25年10月23日 (2013. 10. 23)

(24) 登録日 平成25年7月19日 (2013. 7. 19)

(51) Int. Cl.	F I
AO 1 N 47/40 (2006. 01)	AO 1 N 47/40 Z
AO 1 N 43/22 (2006. 01)	AO 1 N 43/22
AO 1 N 63/02 (2006. 01)	AO 1 N 63/02 B
AO 1 N 53/08 (2006. 01)	AO 1 N 53/00 5 O 8 B
AO 1 N 37/28 (2006. 01)	AO 1 N 37/28

請求項の数 5 (全 39 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2011-507384 (P2011-507384)  
 (86) (22) 出願日 平成20年5月1日 (2008. 5. 1)  
 (65) 公表番号 特表2011-523939 (P2011-523939A)  
 (43) 公表日 平成23年8月25日 (2011. 8. 25)  
 (86) 国際出願番号 PCT/US2008/005613  
 (87) 国際公開番号 W02009/134224  
 (87) 国際公開日 平成21年11月5日 (2009. 11. 5)  
 審査請求日 平成23年4月15日 (2011. 4. 15)

(73) 特許権者 501035309  
 ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ  
 ー  
 アメリカ合衆国 インディアナ州 462  
 68, インディアナポリス, ジオンス  
 ヴィレ ロード, 9330  
 (74) 代理人 100092783  
 弁理士 小林 浩  
 (74) 代理人 100095360  
 弁理士 片山 英二  
 (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

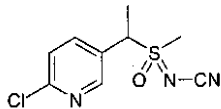
(54) 【発明の名称】 相乗的殺虫混合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(a) 下記化合物:

【化 2 8】



および

(b) スピノサド、スピネトラム、シハロスリン、メトキシフェノジド、またはクロルピリホス、を含む殺虫組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の組成物を、害虫を防除する場所に適用することを含むプロセス。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の組成物を種子に適用するプロセス。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の組成物を、1 つまたは複数の特殊化した形質を発現するように遺伝的に形質転換されている種子に適用するプロセス。

## 【請求項5】

請求項1に記載の組成物を、1つまたは複数の特殊化した形質を発現するように遺伝的に形質転換されている遺伝的形質転換植物に適用するプロセス。

## 【発明の詳細な説明】

## 【技術分野】

## 【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2007年5月1日出願の米国仮特許出願第60/927,119号の優先権を主張するものであり、その開示全体が参照によって本明細書に組み入れられる。

## 【0002】

本明細書に開示する本発明は、殺虫剤の分野に関し、害虫の防除におけるその使用に関する。

## 【背景技術】

## 【0003】

害虫は、毎年、世界中で何百万もの人の死亡を引き起こす。さらに、農業に損失をもたらす害虫が1万種以上存在する。これら農業の損失は、毎年、何十億ドル(米ドル)もの金額になる。シロアリは、家などの様々な建造物に損失をもたらす。これらシロアリの損失は、毎年、何十億ドル(米ドル)もの金額になる。最後に注目することとして、多くの貯蔵食品の害虫は、貯蔵食品を食べ、品質を落とす。これら貯蔵食品の損失は、毎年、何十億ドル(米ドル)もの金額になるが、さらに重要なことに人間から必要な食品を奪う。

## 【発明の概要】

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0004】

新しい殺虫剤が深刻に必要とされている。昆虫は、現在使用されている殺虫剤に対する抵抗性を獲得しつつある。何百種類もの昆虫が、1つまたは複数の殺虫剤に対して抵抗性である。DDT、カルバメート、および有機リンなどの、いくつかの古い殺虫剤に対する抵抗性の獲得はよく知られている。しかし、いくつかの新しい殺虫剤に対する抵抗性も獲得している。したがって、新しい殺虫剤、特に新しい作用機序を有する殺虫剤が必要とされている。

## 【0005】

置換基(非包括的な列挙(NON-EXHAUSTIVE LIST))

置換基の例は、(ハロを除いて)非網羅的(non-exhaustive)であり、本明細書に開示する本発明を制限するものと解釈してはならない。

## 【0006】

「アルコキシ」は、炭素-酸素単結合からさらに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、およびデコキシがある。

## 【0007】

「アルキル」は、炭素および水素からなる、非環式の、飽和の、分枝または非分枝の置換基を意味し、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、およびデシルがある。

## 【0008】

「ハロ」は、フルオロ、クロロ、プロモ、およびヨードを意味する。

## 【0009】

「ハロアルキル」は、1つから可能な最大数の、同一または異なるハロからさらに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、および1,1,2,2-テトラフルオロエチルがある。

10

20

30

40

50

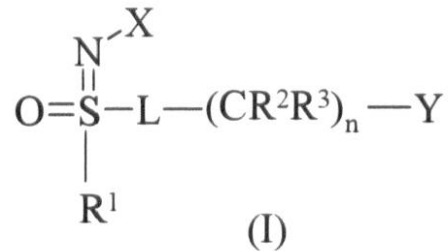
## 【課題を解決するための手段】

【0010】

以下の式の化合物は、様々な他の殺虫剤と相乗的 (synergistic) である。

【0011】

【化1】



10

〔式中、

XはNO<sub>2</sub>、CN、またはCOOR<sup>4</sup>を表し、

Lは単結合を表すか、またはR<sup>1</sup>、SおよびLは一緒になって5員環または6員環を表し、

R<sup>1</sup>はメチルまたはエチルを表し、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は独立に水素、メチル、エチル、フルオロ、クロロ、またはプロモを表し、

20

nは0～3の整数であり、

n = 0～3であり、Lが単結合を表す場合は、Yは6-ハロピリジン-3-イル、6-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルキルピリジン-3-イル、6-ハロ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルキルピリジン-3-イル、6-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルコキシピリジン-3-イル、6-ハロ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルコキシピリジン-3-イル、2-クロロチアゾール-4-イル、もしくは3-クロロイソキサゾール-5-イルを表し、またはn = 0～1であり、R<sup>1</sup>、S、およびLが一緒になって5員環もしくは6員環を表す場合は、Yは水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、フェニル、6-ハロピリジン-3-イル、6-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルキルピリジン-3-イル、6-ハロ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルキルピリジン-3-イル、6-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルコキシピリジン-3-イル、6-ハロ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)アルコキシピリジン-3-イル、2-クロロチアゾール-4-イル、もしくは3-クロロイソキサゾール-5-イルを表し、

30

R<sup>4</sup>はC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルを表す〕。

## 【発明を実施するための形態】

【0012】

スキームHに記載したもの以外のスルホキシイミンの調製方法は、その教示が本明細書に組み入れられる、米国特許出願公開第20050228027号に以前に開示されている。

【0013】

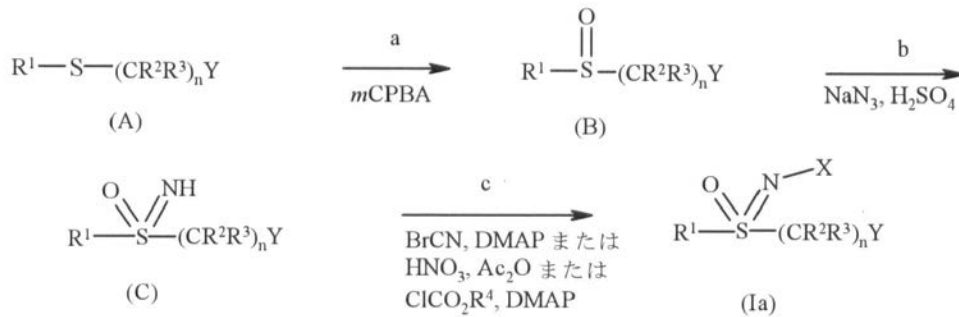
R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、X、およびYが先に定義されている通りであり、Lが単結合である式(Ia)の化合物は、スキームAに図示する方法によって調製することができる。

40

【0014】

## 【化2】

## スキームA



10

## 【0015】

スキームAのステップaにおいて、式(A)の硫黄化合物を0 未満の極性溶媒中メタクロロペルオキシ安息香酸(mCPBA)で酸化すると式(B)の硫黄化合物が得られる。ほとんどの場合においてジクロロメタンが酸化に好ましい溶媒である。

## 【0016】

スキームAのステップbにおいて、硫黄化合物(B)を、加熱下、非プロトン溶媒中濃硫酸の存在下、アジ化ナトリウムでイミン化すると式(C)の硫黄化合物が得られる。ほとんどの場合においてクロロホルムがこの反応に好ましい溶媒である。

20

## 【0017】

スキームAのステップcにおいて、硫黄化合物(C)の窒素を、塩基の存在下、臭化シアンでシアン化し、または穏やかに上げた温度下で、無水酢酸の存在下、硝酸でニトロ化し、または4-ジメチルアミノピリジン(DMAP)などの塩基の存在下アルキル(R<sup>4</sup>)クロロホルメートでカルボキシル化すると、N-置換された硫黄化合物(Ia)が得られる。効率的にシアン化およびカルボキシル化するには塩基が必要とされ、好ましい塩基はDMAPであり、効率的なニトロ化反応のための触媒として硫酸が用いられる。

## 【0018】

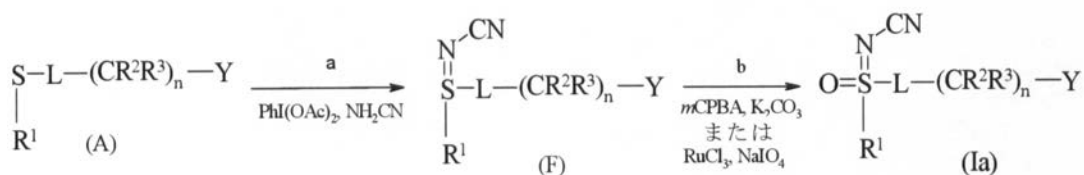
XがCNを表し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、およびYが先に定義した通りである式(Ia)の化合物は、スキームBに図示する、穏やかで効率的な方法によって調製することができる。

30

## 【0019】

## 【化3】

## スキームB



40

## 【0020】

スキームBのステップaにおいて、0 で、シアナミドの存在下、ヨードベンゼン二酢酸で硫黄化合物を酸化するとスルフィリイミン(F)が得られる。反応は、ジクロロメタンなどの極性の、非プロトン溶媒において行うことができる。

## 【0021】

スキームBのステップbにおいて、スルフィリイミン(F)をmCPBAで酸化する。炭酸カリウムなどの塩基を使用してmCPBAの酸性を中和する。エタノールおよび水などのプロトン性の極性溶媒を用いて、使用するスルフィリイミンの出発材料および塩基の

50

溶解性を増大する。スルフィリミン (F) を、三塩化ルテニウム水和物触媒または類似の触媒の存在下、ペルイオディネート (periodinate) ナトリウムまたはペルイオディネートカリウムの水溶液で酸化することもできる。この触媒用の有機溶媒は、ジクロロメタン、クロロホルム、またはアセトニトリルなどの極性の非プロトン溶媒であってよい。

【0022】

式 (Ia) の N - 置換したスルホキシイミンの、すなわち、 $n = 1$  であって、N - 置換されたスルホキシイミン官能基に隣接する ( $CR^2R^3$ ) 基における  $R^3 = H$  である炭素は、ヘキサメチルジシラミドカリウム (KHMDS) などの塩基の存在下、さらにアルキル化またはハロゲン化 ( $R^5$ ) されて式 (Ib) の N - 置換されたスルホキシイミンを生成し、式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $X$ 、 $L$ 、および  $Y$  は先に定義した通りであり、 $Z$  はスキーム C において図示するような好適な脱離基 (leaving group) である。好ましい脱離基は、ヨウ化物 ( $R^5 = \text{アルキル}$ )、ベンゼンスルホンイミド ( $R^5 = F$ )、テトラクロロエテン ( $R^5 = Cl$ )、およびテトラフルオロエテン ( $R^5 = Br$ ) である。

【0023】

【化4】

### スキーム C



【0024】

スキーム A における出発のスルフィド (A) は、スキーム D、E、F、G、H、および I に図示するように異なる方法において調製することができる。

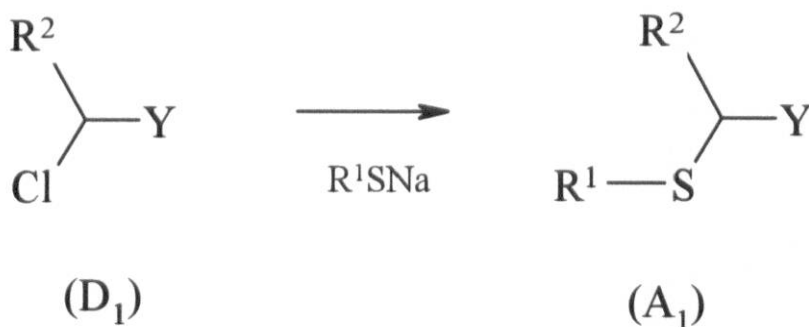
【0025】

スキーム D において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、および  $Y$  が先に定義した通りであり、 $n = 1$  であり、 $R^3 = H$  である式 ( $A_1$ ) のスルフィドは、アルキルチオールナトリウム塩との求核置換によって、式 ( $D_1$ ) の塩化物から調製することができる。

【0026】

【化5】

### スキーム D



【0027】

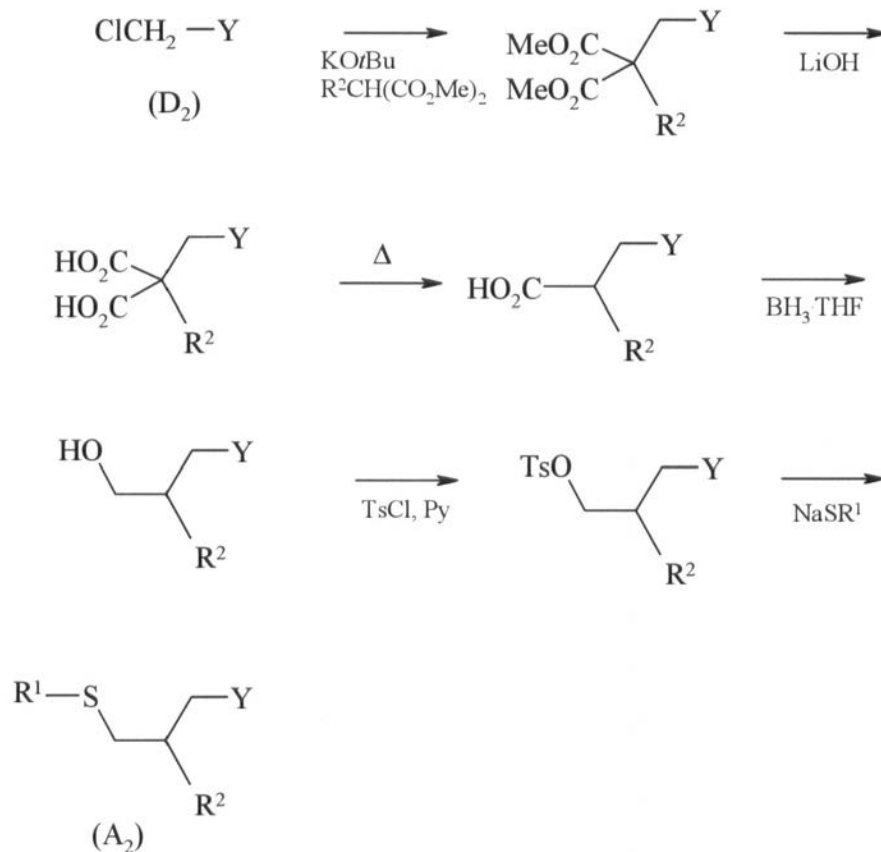
スキーム E において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、および Y が先に定義した通りであり、 $n = 3$  であり、 $R^3 = H$  である式 (A<sub>2</sub>) のスルフィドは、tert-ブトキシドカリウムなどの塩基の存在下、2-モノ置換されたメチルマロネートと反応することによって 2,2-二置換されたマロネートを生成し、塩基性の条件下で加水分解して二価酸を形成し、加熱により二価酸を脱炭酸反応して一酸を生成し、一酸をボラン-テトラヒドロフラン (tetrahydrofuran) 錯体で還元してアルコールを生成し、アルコールをピリジンなどの塩基の存在下でトシルクロライド (トシルクロライド) でトシル化してトシル化物を生じ、トシル化物を所望のチオールのナトリウム塩で置換することによって式 (D<sub>2</sub>) の塩化物から調製することができる。

【 0 0 2 8 】

10

【化 6】

## スキーム E



20

30

【 0 0 2 9 】

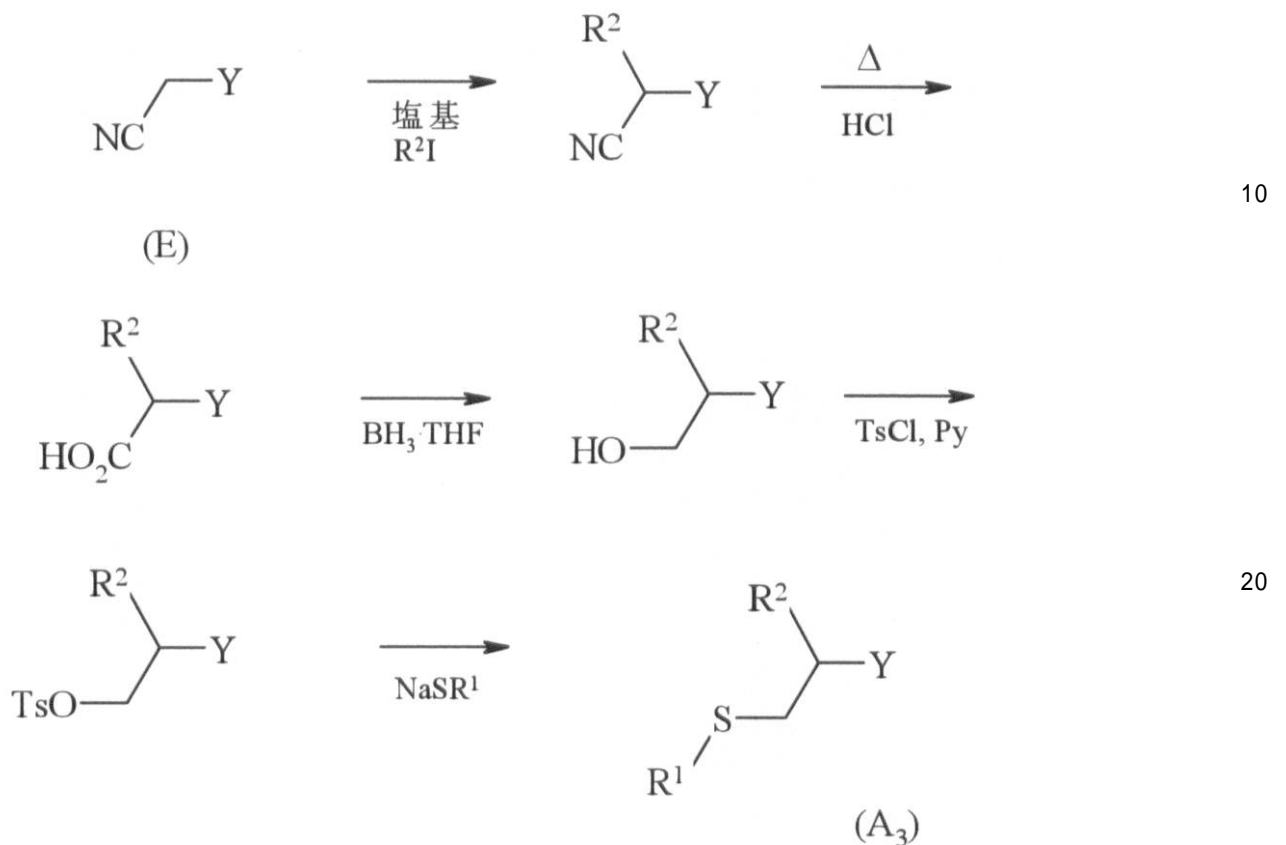
スキーム F において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、および Y が先に定義した通りであり、 $n = 2$  であり、 $R^3 = H$  である式 (A<sub>3</sub>) のスルフィドは、強塩基で脱プロトン化し、アルキルヨウ化物でアルキル化して  $\alpha$ -アルキル化されたニトリルを生成し、HCl などの強酸の存在下で  $\alpha$ -アルキル化されたニトリルを加水分解して酸を生成し、酸をボラン-テトラヒドロフラン錯体で還元してアルコールを生成し、アルコールをピリジンなどの塩基の存在下トシルクロライドでトシル化してトシル化物を生成し、トシル化物を所望のチオールのナトリウム塩で置換することによって式 (E) のニトリルから調製することができる。

40

【 0 0 3 0 】

【化7】

## スキーム F



【0031】

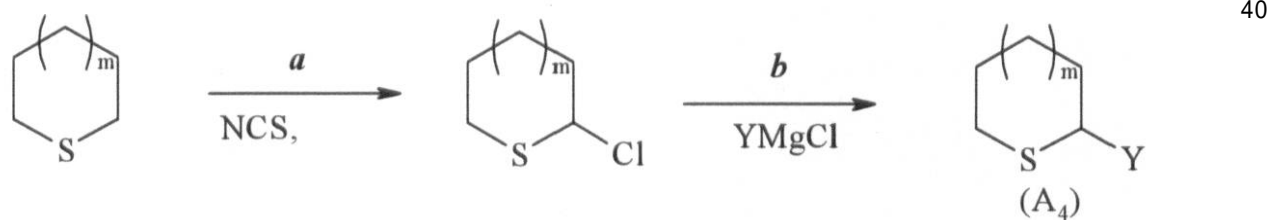
スキーム Gにおいて、R<sup>1</sup>、S、およびLが一緒になって環を形成し、n = 0でありY = イソプロピルまたはフェニルである式(A<sub>4</sub>)の硫黄化合物は、m = 0、1である非置換の環状硫黄化合物から調製することができる。環状硫黄化合物の出発材料をベンゼン中N-クロロスクシンイミドで塩素化し、引き続きグリニャール試薬でアルキル化して十分な収量の所望の硫黄化合物(A<sub>4</sub>)をもたらすことができる。

30

【0032】

【化8】

## スキーム G



【0033】

R<sup>1</sup>、S、およびLが一緒になって環を形成し、n = 0、m = 0でありY = 6-ハロ、6-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、6-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)ハロアルキル、または6-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルコキシ置換した3-ピリジルである式(A<sub>4</sub>)の硫黄化合物の調製に対する代替

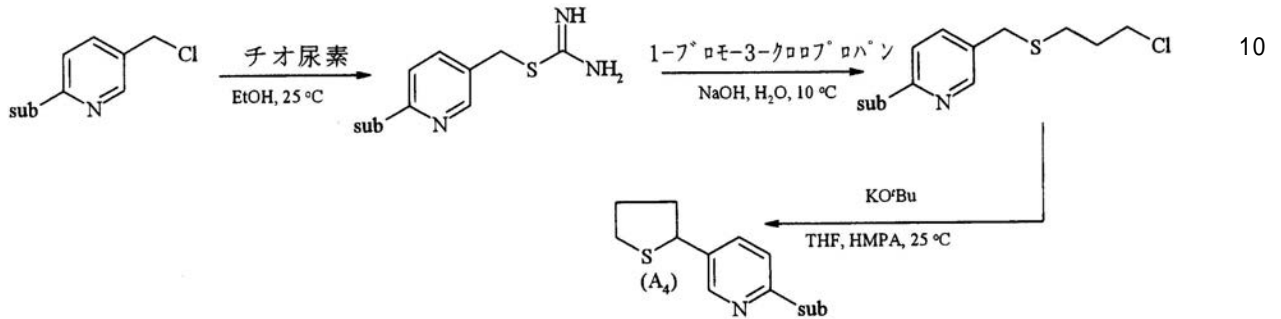
50

法を、スキームHに強調する。したがって、対応する、好適に置換されているクロロメチルピリジンをチオ尿素で処理し、加水分解し、引き続き水性の塩基の条件下で1-プロモ-3-クロロプロパンでアルキル化し、テトラヒドロフラン (THF) などの極性の、非プロトン溶媒中、tert-ブトキシドカリウムなどの塩基の存在下で環化する。

【0034】

【化9】

### スキームH



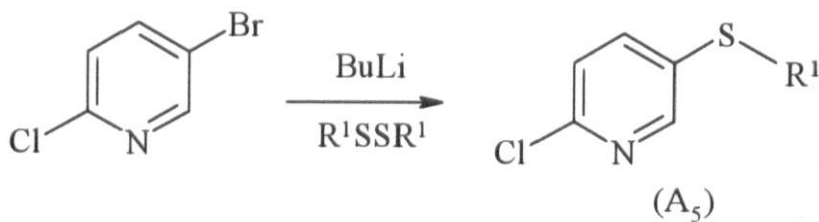
【0035】

スキームIにおいて、 $R^1$  が先に定義した通りであり、Lが結合であり、 $n = 0$  であり、Yが6-クロロピリジン-3-イルである式(A<sub>5</sub>)のスルフィドは、2-クロロ-5-プロモピリジンから、ハロ-金属交換、および引き続きジスルフィドでの置換によって調製することができる。

【0036】

【化10】

### スキームI



【0037】

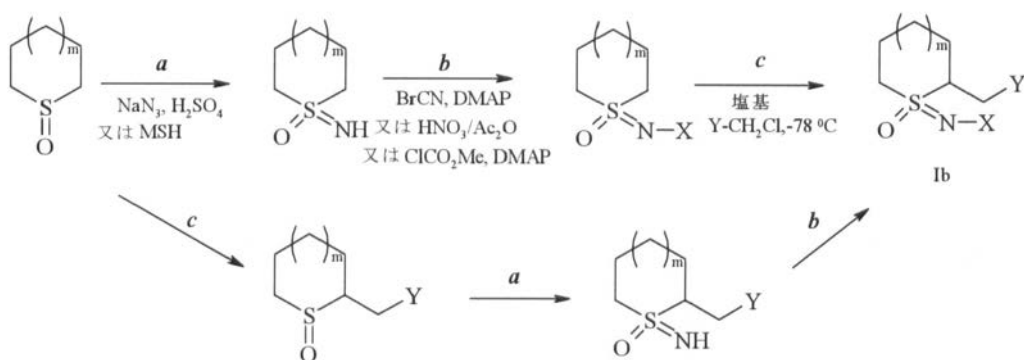
$R^1$ 、S、およびLが一緒になって飽和5員環または6員環を形成し、 $n = 1$  であるIb型のスルホキシミン化合物は、XおよびYが先に定義した通りであり、mが0または1であるスキームJに図示する方法によって調製することができる。

【0038】

40

## 【化 1 1】

## スキーム J



10

## 【0039】

スキーム A のステップ b に類似の、スキーム J のステップ a において、スルホキシドを、濃硫酸の存在下アジ化ナトリウムで、または極性の非プロトン溶媒中 O - メチルスルホニルヒドロキシアミンでイミン化してスルホキシミンが得られる。クロロホルムまたはジクロロメタンが好ましい溶媒である。

## 【0040】

スキーム A のステップ c に類似の、スキーム J のステップ b において、スルホキシミンの窒素を、臭化シアンでシアン化し、または硝酸でニトロ化し、引き続き還流条件下、無水酢酸で処理することによって、または DMAP などの塩基の存在下メチルクロロホルメートでカルボキシ化することによって、N - 置換されている環状スルホキシミンが得られる。効率的なシアン化およびカルボキシル化に塩基が必要とされ、好ましい塩基は DMAP であり、効率的なニトロ化反応に対する触媒として硫酸が用いられる。

20

## 【0041】

スキーム J のステップ c において、N - 置換されたスルホキシミンの炭素を、KHMDS またはブチルリチウム (BuLi) などの塩基の存在下、複素環式芳香族のハロゲン化メチルでアルキル化して所望の N - 置換されたスルホキシ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、またはヨウ化物であってよい。

30

## 【0042】

あるいは、式 (Ib) の化合物は、スキーム J に対して上記に記載したステップ c、a、および b をそれぞれ用いることによって、最初にスルホキシドをアルキル化して置換されたスルホキシドを得、次いでスルホキシドをイミン化し、引き続き得られたスルホキシミンの N - 置換によって調製することができる。

## 【0043】

Y が、6 - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) ハロアルキルピリジン - 3 - イルおよび 6 - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) ハロアルコキシピリジン - 3 - イル以外の請求されている置換基を表す化合物は、その教示が本明細書に組み入れられる米国特許出願公開第 20050228027 号に開示されている。

40

## 【実施例】

## 【0044】

実施例は、例示のためであって、本明細書に開示する本発明を本実施例に開示する実施形態だけに限定するものと解釈してはならない。

## 【0045】

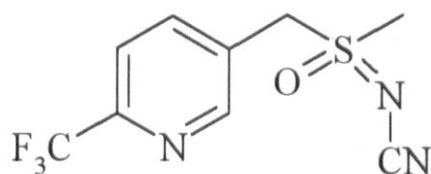
## 【実施例 I】

[(6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル)メチル] (メチル) - オキシド - 4 - スルファニリデンシアナミド (1)

## 【0046】

50

【化 1 2】



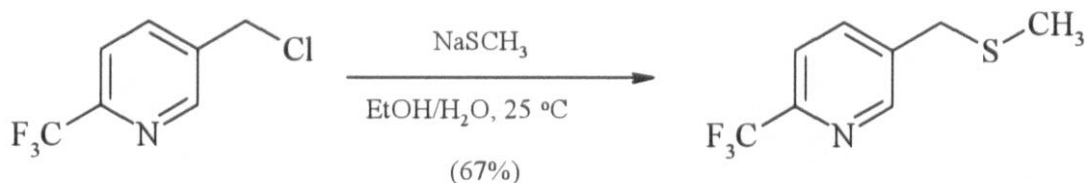
(1)

〔(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メチル〕(メチル)-オキシド-4-スルファニリデンシアナミド(1)を、以下の3ステップの順序に従って3-クロロメチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジンから調製した。

【0047】

【化 1 3】

(A)



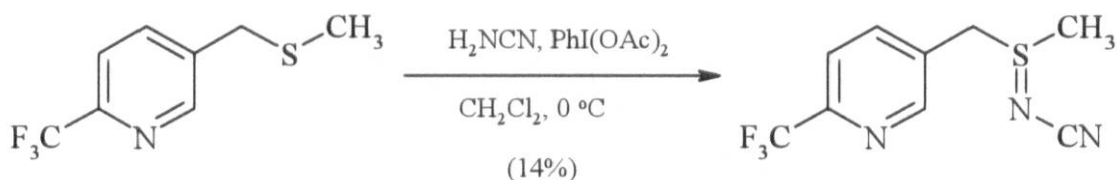
(A)

3-クロロメチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン(5.1g、26mmol)のジメチルスルホキシド(DMSO; 20mL)溶液に、チオメトキシドナトリウム(1.8g、26mmol)を一度に加えた。激しい発熱反応が観察され、反応液が暗色となった。反応液を1時間攪拌し、次いでさらなるチオメトキシドナトリウム(0.91g、13mmol)をゆっくりと加えた。反応液を一夜攪拌し、その後反応液をH<sub>2</sub>Oに注ぎ、濃HClを数滴加えた。混合液をEt<sub>2</sub>O(3×50mL)で抽出し、有機層を合わせ、塩水で洗浄し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。粗製の生成物をクロマトグラフィーによって精製して(Prep 500、10%アセトン/ヘキサン)淡黄色油状物のスルフィド(A)(3.6g、67%)を得た。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.6 (s, 1H), 7.9 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 3.7 (s, 2H), 2.0 (s, 3H); GC-MS: C<sub>8</sub>H<sub>8</sub>F<sub>3</sub>NS [M]<sup>+</sup>の質量計算値207. 実測値207.

【0048】

【化 1 4】

(B)



(A)

(B)

10

20

30

40

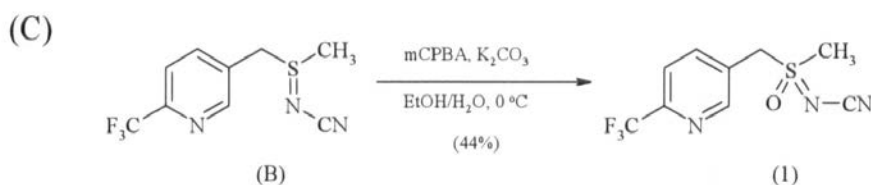
50

0 の、スルフィド (A) (3.5 g、17 mmol) およびシアナミド (1.4 mg、34 mmol) のジクロロメタン (30 mL) 溶液に、ヨードベンゼン二酢酸 (11.0 g、34 mmol) を一度に加えた。反応液を 30 分間攪拌し、次いで、一夜、室温まで温めた。混合物をジクロロメタン (50 mL) で希釈し、H<sub>2</sub>O で洗浄した。水層を酢酸エチルで抽出し (4 × 50 mL)、ジクロロメタン層と酢酸エチル層とを合わせたものを MgSO<sub>4</sub> で乾燥し、濃縮した。粗製の生成物をヘキサンで粉末にし (trituated)、クロマトグラフィーによって精製して (クロマトロン (chromatotron)、60% アセトン/ヘキサン) 黄色ゴム状 (yellow gum) のスルフィルイミン (B) (0.60 g、14%) を得た。IR (フィルム) 3008, 2924, 2143, 1693 cm<sup>-1</sup>; <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.8 (s, 1H), 8.0 (d, 1H), 7.8 (d, 1H), 4.5 (d, 1H), 4.3 (d, 1H), 2.9 (s, 3H); LC-MS (ESI): C<sub>9</sub>H<sub>9</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>S [M+H]<sup>+</sup> の質量計算値 248.04. 実測値 248.

10

【0049】

【化15】



0 の、*m*-クロロ過安息香酸 (mCPBA; 80%, 1.0 g、4.0 mmol) の EtOH (10 mL) 溶液に、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1.4 g、10 mmol) の H<sub>2</sub>O (7 mL) 溶液を加えた。溶液を 20 分間攪拌し、次いでスルフィルイミン (B) (0.60 g、2.4 mmol) の EtOH (20 mL) 溶液を一度に加えた。反応液を 0 で 30 分間攪拌し、次いで 1 時間かけて室温に温めた。重亜硫酸ナトリウム水溶液で反応を停止し、混合物を濃縮してエタノールを除去した。得られた混合物をジクロロメタンで抽出し、有機層を合わせて MgSO<sub>4</sub> で乾燥し、濃縮した。粗製の生成物をクロマトグラフィーによって精製して (クロマトロン、50% アセトン/ヘキサン) オフホワイト固体のスルホキシイミン (1) (0.28 g、44%) を得た。Mp = 135 ~ 137 °C。 <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.8 (s, 1H), 8.1 (d, 1H), 7.8 (d, 1H), 4.7 (m, 2H), 3.2 (s, 3H); LC-MS (ELSD): C<sub>9</sub>H<sub>9</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>OS [M+H]<sup>+</sup> の質量計算値 264.04. 実測値 263.92.

20

30

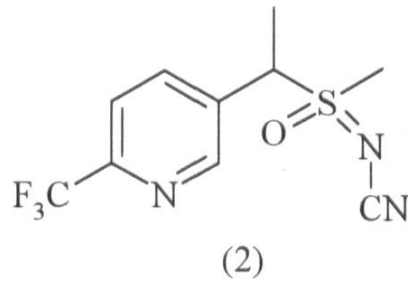
【0050】

[実施例 II]

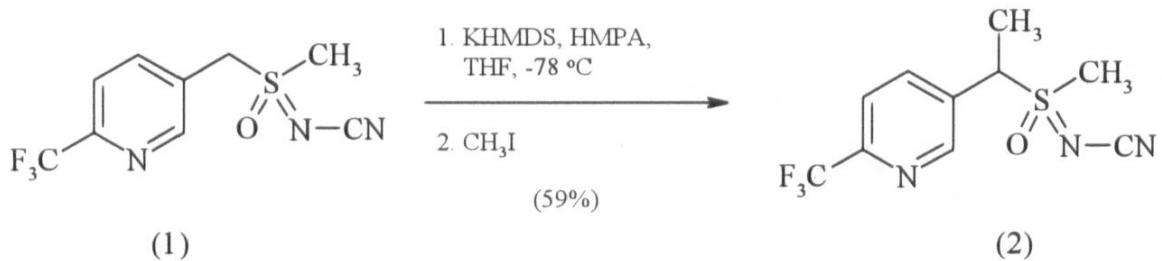
[1 - (6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル) エチル] (メチル) - オキシド - 4 - スルファニリデンシアナミド (2)

【0051】

## 【化 16】



(A)



[ 1 - ( 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル ) エチル ] ( メチル ) - オキシド - 4 - スルファニリデンシアナミド ( 2 ) を、スキーム C に概略した方法を用いて [ ( 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル ) メチル ] ( メチル ) - オキシド - 4 - スルファニリデンシアナミド ( 1 ) から調製した。

## 【 0 0 5 2 】

- 78 の、スルホキシイミン ( 1 ) ( 50 mg、0.19 mmol ) およびヘキサメチルホスホラミド ( HMPA ; 17  $\mu\text{L}$ 、0.10 mmol ) のテトラヒドロフラン ( THF ; 2 mL ) 溶液に、ヘキサメチルジシラザンカリウム ( KHMDs ; トルエン中 0.5 M、420  $\mu\text{L}$ 、0.21 mmol ) を滴加した。溶液を - 78 でさらなる 20 分間攪拌し、その後ヨードメタン ( 13  $\mu\text{L}$ 、0.21 mmol ) を加えた。反応液を 1 時間かけて室温に温め、その後飽和  $\text{NH}_4\text{Cl}$  水溶液 ( aq. ) で反応を停止し、ジクロロメタンで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、濃縮し、粗製の生成物をクロマトグラフィーによって精製して ( クロマトロン、70% アセトン /  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  ) ジアステレオマーの 2 : 1 混合物のスルホキシイミン ( 2 ) ( 無色油状物 ; 31 mg、59% ) を得た。 $^1\text{H NMR}$  ( 300 MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) : ( 主ジアステレオマー ) 8.8 ( s, 1H ), 8.1 ( d, 1H ), 7.8 ( d, 1H ), 4.6 ( q, 1H ), 3.0 ( s, 3H ), 2.0 ( d, 3H ); ( 副ジアステレオマー ) 8.8 ( s, 1H ), 8.1 ( d, 1H ), 7.8 ( d, 1H ), 4.6 ( q, 1H ), 3.1 ( s, 3H ), 2.0 ( d, 3H ); LC-MS ( ELS D ) :  $\text{C}_{10}\text{H}_{10}\text{F}_3\text{N}_3\text{OS}$  [ M+H ]  $^+$  の質量計算値 278.06. 実測値 278.05.

## 【 0 0 5 3 】

## [ 実施例 I I I ]

2 - ( 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル ) - 1 - オキシド - テトラヒドロ - 1 H - 1 - 4 - チエン - 1 - イリデンシアナミド ( 3 )

## 【 0 0 5 4 】

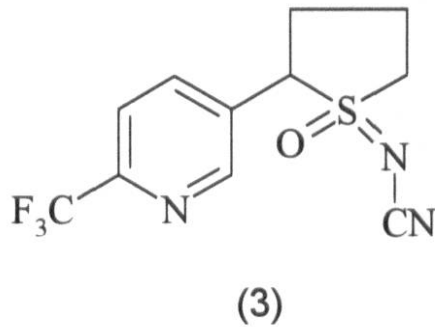
10

20

30

40

## 【化17】



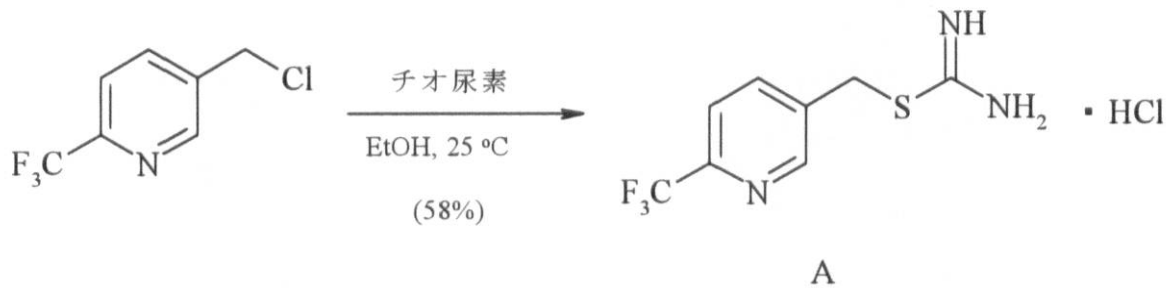
10

2 - (6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - イル) - 1 - オキシド - テトラヒドロ - 1 H - 1<sup>4</sup> - チエン - 1 - イリデンシアナミド (3) を、以下に概略する 5 ステップの順序に従って、3 - クロロメチル - 6 - (トリフルオロメチル) - ピリジンから調製した。

## 【0055】

## 【化18】

## (A)



20

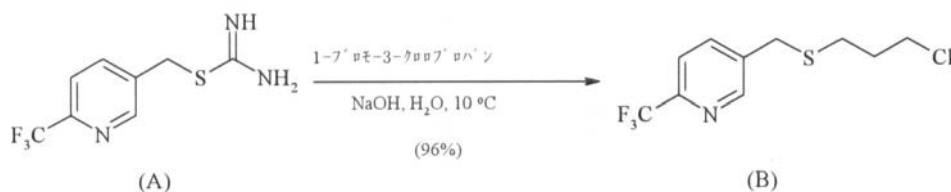
チオ尿素 (1.2 g、16 mmol) の EtOH (25 mL) 懸濁液に、3 - クロロメチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジンの EtOH (10 mL) 溶液を加えた。懸濁液を室温で 2 日間攪拌し、その間に白色の沈殿物が形成された。沈殿物をろ過して、白色固体の所望のアミジン塩酸塩 (2.4 g、58%) を得た。Mp = 186 ~ 188。生成物を精製するためのさらなる試みは行わなかった。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.9 (bs, 4H), 8.4 (s, 1H), 7.6 (d, 1H), 7.3 (d, 1H), 4.2 (s, 2H); LC-MS (ELSD): C<sub>8</sub>H<sub>8</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>S [M+H]<sup>+</sup>の質量計算値236.05。実測値236.01。

30

## 【0056】

## 【化19】

## (B)



40

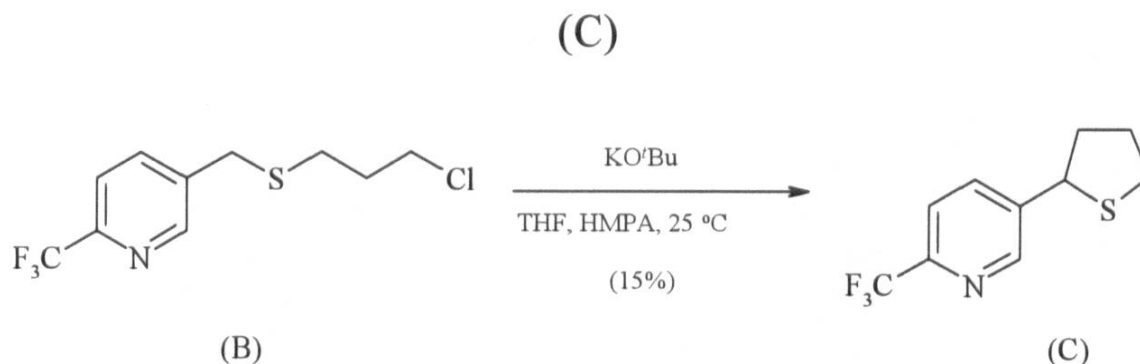
10 のアミジン塩酸塩 (A) (1.8 g、6.8 mmol) の H<sub>2</sub>O (12 mL) 溶液に、10 N NaOH (0.68 mL、6.8 mmol) を加え、白色沈殿物の形成がもたらされた。懸濁液を 100 で 30 分間加熱し、次いで冷却して 10 に戻した。さらなる 10 N NaOH (0.68 mL、6.8 mmol) を加え、引き続き 1 - ブロモ - 3 - クロロプロパン (0.67 mL、6.8 mmol) を一度に加えた。反応液を室温

50

で一夜攪拌し、次いでジクロロメタンで抽出した。有機層を合わせ、塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥し、濃縮し、無色油状物のスルフィド(B)(1.7g、96%)を得た。生成物を精製するためのさらなる試みは行わなかった。 $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.6 (s, 1H), 7.8 (d, 1H), 7.6 (d, 1H), 3.8 (s, 2H), 3.6 (t, 2H), 2.6 (t, 2H), 2.0 (五重線, 2H).

【0057】

【化20】



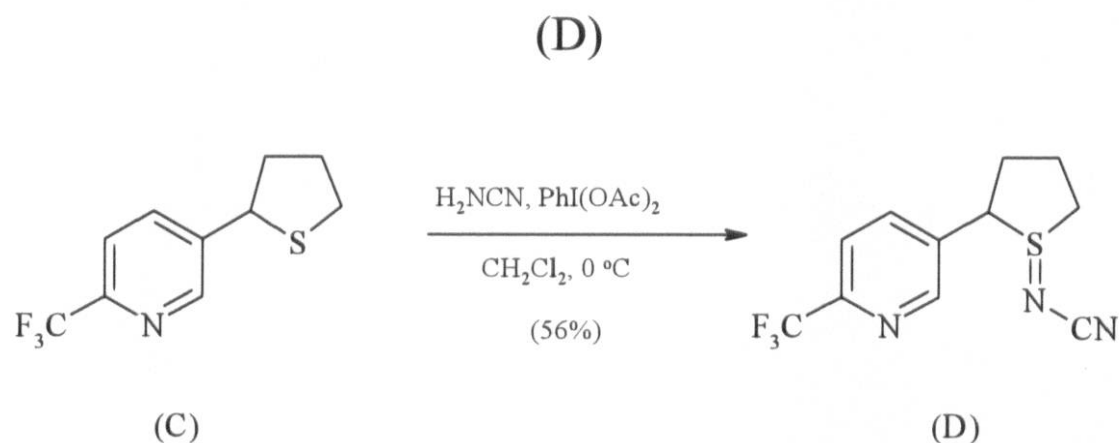
10

tert-ブトキシドカリウム(1.5g、13mmol)のTHF(12mL)懸濁液にHMPA(1.7mL、10mmol)を加え、引き続きスルフィド(B)(1.8g、6.7mmol)のTHF溶液(3mL)を滴加した。反応液を室温で一夜攪拌し、引き続きクロマトグラフィー(Biotage、40%EtOAc/ヘキサン)によって濃縮および精製して、橙色油状物の環状生成物(C)(230mg、15%)を得た。 $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.7 (s, 1H), 8.0 (d, 1H), 7.6 (d, 1H), 4.6 (dd, 1H), 3.2 (m, 1H), 3.1 (m, 1H), 2.5 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 2.1-1.9 (m, 2H).

20

【0058】

【化21】



30

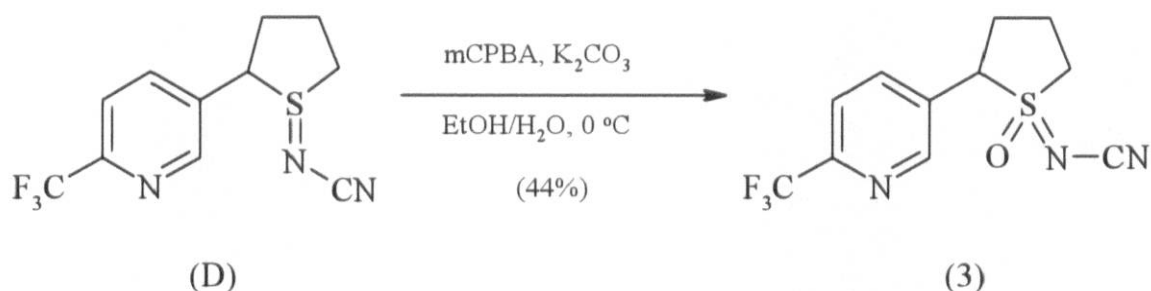
0 のスルフィド(C)(230mg、0.99mmol)およびシアナミド(83mg、2.0mmol)のジクロロメタン(5mL)溶液に、ヨードベンゼン二酢酸(350mg、1.1mmol)を一度に加えた。反応液を3時間攪拌し、次いで濃縮し、粗製生成物をクロマトグラフィーによって精製して(クロマトロン、50%アセトン/ヘキサン)橙色油状物のスルフィルイミン(D)(150mg、ジアステレオマーの混合物、56%)を得た。 $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.8 (s, 1H), 7.9 (d, 1H), 7.8 (d, 1H), 4.8 (dd, 1H), 3.5 (m, 2H), 2.9-2.7 (m, 2H), 2.6 (m, 1H), 2.3 (m, 1H).

40

【0059】

【化22】

(E)



10

0 の mCPBA (80%、180 mg、0.82 mmol) の EtOH (3 mL) 溶液に、 $K_2CO_3$  (230 mg、1.7 mmol) の  $H_2O$  (1.5 mL) 溶液を加えた。溶液を 20 分間攪拌し、次いでスルフィルイミン (D) (150 mg、0.55 mmol) の EtOH (2 mL) 溶液を一度に加えた。反応液を 0 で 45 分間攪拌し、その後溶媒を別々のフラスコ中にデカントし、濃縮して白色固体を得た。固体を  $CHCl_3$  中スラリー状にし、ろ過し、濃縮して無色油状物の純粋なスルホキシイミン (3) (72 mg、44%) を得た。 $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ ): (ジアステレオマーの 1.5:1 の混合物) 8.8 (s, 2H), 8.0 (d, 2H), 7.8 (d, 2H), 4.7 (q, 1H), 4.6 (q, 1H), 4.0-3.4 (m, s, 4H), 3.0-2.4 (m, 8H); LC-MS (ELSD):  $C_{11}H_{11}F_3N_3OS$   $[M+H]^+$  の質量計算値 290.06. 実測値 289.99.

20

【0060】

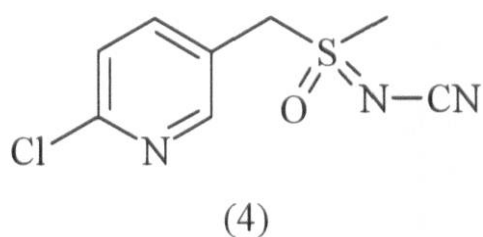
[実施例IV]

[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル](メチル)オキシド-<sup>4</sup>-スルファニリデン-シアナミド(4)

【0061】

【化23】

30



[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル](メチル)オキシド-<sup>4</sup>-スルファニリデンシアナミド(4)を、実施例Iに概略したのと同じ3ステップの順序によって、3-クロロメチル-6-クロロピリジンから調製した。生成物は白色固体であった。mp = 115 ~ 117。  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CD_3OD/CDCl_3$ ) 8.5 (d, 1H), 8.0 (dd, 1H), 7.6 (d, 1H), 5.0 (s, 2H), 3.4 (s, 3H); LC-MS (ELSD):  $C_8H_9ClN_3OS$   $[M+H]^+$  の質量計算値 230. 実測値 230.

40

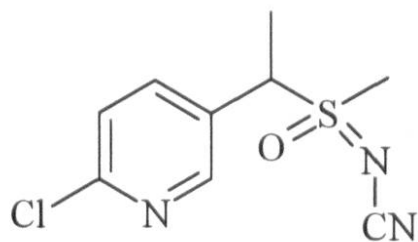
【0062】

[実施例V]

[1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル](メチル)オキシド-<sup>4</sup>-スルファニリデン-シアナミド(5)

【0063】

## 【化 2 4】



(5)

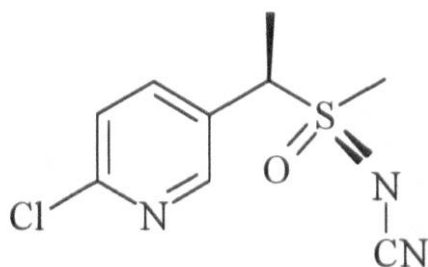
10

【 1 - ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) エチル ] ( メチル ) オキシド - <sup>4</sup> - スルファニリデンシアナミド ( 5 ) を、実施例 I I に記載したのと同じプロトコールによって、【 ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) メチル ] ( メチル ) オキシド - <sup>4</sup> - スルファニリデンシアナミド ( 4 ) から調製した。ジアステレオマーの 3 : 2 混合物として単離された最終生成物は、オフホワイト固体であった。mp = 155 ~ 164 。 LC - MS ( ELS D ) : C<sub>9</sub>H<sub>9</sub>ClN<sub>3</sub>OS [ M - H ]<sup>+</sup> の質量計算値 242 。実測値 242 。 ( 5 ) のジアステレオマーは再結晶 ( 2 : 1 MeOH / H<sub>2</sub>O ) によって分離することができ、引き続き上清のクロマトクロマトグラフィーで ( 6 ) および ( 7 ) ( 立体化学構造は任意に割り当てる ) がもたらされた。

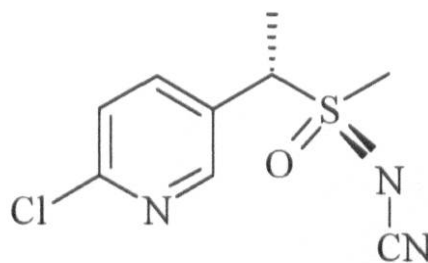
20

## 【 0 0 6 4】

## 【化 2 5】



(6)



(7)

30

化合物 ( 6 ) を白色固体として単離した。mp = 163 ~ 165 。 <sup>1</sup>H NMR ( 300 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) : 8.4 ( d, 1H ), 7.9 ( dd, 1H ), 7.5 ( d, 1H ), 4.6 ( q, 1H ), 3.1 ( s, 3H ), 2.0 ( d, 3H ); LC-MS ( ELS D ) : C<sub>9</sub>H<sub>11</sub>ClN<sub>3</sub>OS [ M+H ]<sup>+</sup> の質量計算値, 244. 実測値 244.

## 【 0 0 6 5】

化合物 ( 7 ) を無色油状物として単離した。 <sup>1</sup>H NMR ( 300 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) 8.4 ( d, 1H ), 7.9 ( dd, 1H ), 7.5 ( d, 1H ), 4.6 ( q, 1H ), 3.0 ( s, 3H ), 2.0 ( d, 3H ); LC-MS ( ELS D ) : C<sub>9</sub>H<sub>11</sub>ClN<sub>3</sub>OS [ M+H ]<sup>+</sup> の質量計算値, 244. 実測値 244.

## 【 0 0 6 6】

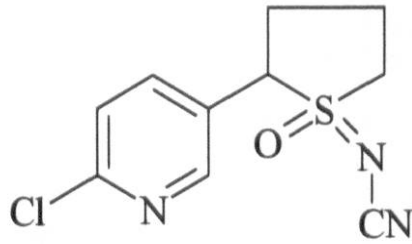
40

## [ 実施例 V I ]

2 - ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) - 1 - オキシド - テトラヒドロ - 1 H - 1 <sup>4</sup> - チエン - 1 - イリデンシアナミド ( 8 )

## 【 0 0 6 7】

## 【化 2 6】



(8)

10

2 - ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) - 1 - オキッド - テトラヒドロ - 1 H - 1 4 - チエン - 1 - イリデンシアナミド ( 8 ) を、実施例 I I I に記載したのと同じ 5 ステップの順序に従って 3 - クロロメチル - 6 - クロロピリジンから調製した。生成物は無色ゴム状で、1 : 1 比のジアステレオマーであった。ジアステレオマー 1: IR (フィルム) 3439, 3006, 2949, 2194  $\text{cm}^{-1}$ ;  $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.4 (d, 1H), 7.8 (dd, 1H), 7.4 (d, 1H), 4.6 (dd, 1H), 3.6 (m, 2H), 2.4-2.7 (m, 4H); GC-MS:  $\text{C}_{10}\text{H}_{11}\text{ClN}_3\text{OS}$  [M+H]<sup>+</sup>の質量計算値256. 実測値256. ジアステレオマー 2: IR (フィルム) 3040, 2926, 2191  $\text{cm}^{-1}$ ;  $^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.4 (d, 1H), 7.8 (dd, 1H), 7.4 (d, 1H), 4.7 (dd, 1H), 3.8 (ddd, 1H), 3.4 (m, 1H), 2.8 (m, 1H), 2.6 (m, 2H), 2.3 (m, 1H); GC-MS:  $\text{C}_{10}\text{H}_{11}\text{ClN}_3\text{OS}$  [M+H]<sup>+</sup>の質量計算値256. 実測値256.

20

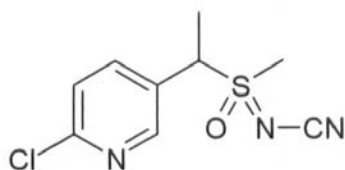
## 【 0 0 6 8】

スルホキシイミンおよび選択された殺虫剤の混合物を用いたモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する殺虫試験

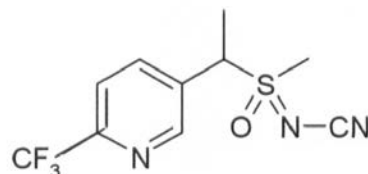
## 【 0 0 6 9】

以下の化合物:

## 【化 2 7】



化合物 1



化合物 2

30

スピノサド、スピネトラム、シハロスリン、メトキシフェノジド、またはクロルピリホスの間の混合物のモモアカアブラムシに対する相乗作用を評価するために、用量反応性の、葉の噴霧アッセイを設計し、実施した。

## 【 0 0 7 0】

アッセイ 1: 技術的材料を 1 mg/ml のアセトン : MeOH (1 : 1) に溶解することによって、1000 ppm のマスター溶液を作成した。2 つの試験化合物間の混合物に対して、各成分からのマスター溶液 0.047 ml を合わせ、アセトン : MeOH 溶媒で 32 x 希釈し (組合せ 0.094 ml + 溶媒 2.906 ml、それぞれに対して 15.6 ppm を得る)、次いで H<sub>2</sub>O (12 ml) 中 0.025% Tween 20 で 5 x 希釈して 3.125 ppm 溶液を得た。非混合物に対して、マスター溶液をアセトン : MeOH で 64 x 希釈し (0.047 ml + 2.953 ml 溶媒、15.6 ppm を得る)、次いで H<sub>2</sub>O 中 (12 ml) 0.025% Tween 20 で 5 x 希釈して 3.125 ppm 溶液を得た。混合物および非混合物の両方に対して、高濃度 (3.125 ppm から出発して) 4 ml を、H<sub>2</sub>O 中 0.025% Tween 20 80 部 (parts) およびアセトン : MeOH 20 部からなる希釈液 12 ml で段階希釈することにより、低濃度 (0.78

40

50

、0.195、0.049、および0.012 ppm)を調製した。

【0071】

アッセイ2: 1 mg/mlのアセトン: MeOH (1:1)に技術的材料を溶解することによって、1000 ppmのマスター溶液を作成した。化合物2および化合物3、4、または5との間の混合物に対して、各成分からのマスター溶液0.047 mlを合わせ、アセトン: MeOH (0.094 mlの組合せ+2.906 ml、それぞれに対して15.6 ppmを得る)で32x希釈し、次いでH<sub>2</sub>O (12 ml)中0.025% Tween 20で5x希釈して3.125 ppm溶液を得た。化合物2と化合物6または7との間の混合物では、化合物2からのマスター溶液0.047 mlおよび化合物6または7からのマスター溶液0.752 mlを合わせ、アセトン: MeOHで3.755x希釈し(0.799 mlの組合せ+溶媒2.201 ml、化合物2に対して15.6 ppm、化合物6または7に対して250 ppmを得る)、次いでH<sub>2</sub>O (12 ml)中0.025% Tween 20で5x希釈して化合物2に対して3.125 ppmの溶液を、化合物6または7に対して50 ppmの溶液を得た。化合物2、3、4、または5との非混合液に対して、マスター溶液をアセトン: MeOHで64x希釈し(0.047 ml+溶媒2.953 ml、15.6 ppmを得る)、次いでH<sub>2</sub>O (12 ml)中0.025% Tween 20で5x希釈して3.125 ppm溶液を得た。化合物6または7との非混合液に対して、マスター溶液をアセトン: MeOHで3.989x希釈し(0.752 ml+溶媒2.248 ml、250 ppmをもたらす)、次いでH<sub>2</sub>O (12 ml)中0.025% Tween 20で5x希釈して50 ppm溶液を得た。混合物および非混合物の両方に対して、高比率(3.125 ppmまたは50 ppmから出発して)4 mlを、H<sub>2</sub>O中0.025% Tween 20 80部およびアセトン: MeOH (1:1) 20部からなる希釈液12 mlで段階希釈することによって、低濃度(化合物2、3、4、および5に対して0.78、0.195、0.049、および0.012 ppm、化合物6および7に対して12.5、3.125、0.78、および0.195 ppm)を調製した。

10

20

【0072】

アッセイ1および2の両方に対して、3インチポットに育てた、2~3枚の小さな(3~5 cm)本葉のついたキャベツ苗を試験基質(substrate)として用いた。苗は、化学物質を適用する1日前に20~50匹のモモアカアブラムシ(無翅の成虫および蛹)を寄生させた(infested)。各処置に苗を4本使用した。流出するまでキャベツ葉の両面に溶液を噴霧するのに、手持ち式のDevilbiss噴霧器を用いた。対照の植物(溶媒チェック)には希釈液(diluent)のみを噴霧した。処置した植物は、等級付けの前に3日間、約23% RH 40%の待機室に保持した。顕微鏡下で植物1個あたりの生存するアブラムシの数を計数することによって評価を行った。殺虫活性(insecticidal activity)を、Abbotの補正式: 補正%防除(Corrected % Control) =  $100 \times (X - Y) / X$  (式中、X = 溶媒チェック植物上の生存しているアブラムシ数、Y = 処置した植物上の生存しているアブラムシ数)を用いることによって測定した。

30

【0073】

【表 1】

表 1 結果

化合物 A	化合物 B	試験濃度 ppm		モモアカアブラムシの%防除	
		化合物 A	化合物 B	測定した 組合せ	Colby の計算からの 予想値*
1	スピノサド	0.01	0.01	35.71	0.00
1	スピノサド	0.78	0.78	37.50	0.00
1	スピノサド	0.20	0.20	40.18	0.00
1	スピノサド	0.78	0.78	69.64	49.55
1	スピノサド	3.13	3.13	93.75	76.83
1	スピネトラム	0.01	0.01	25.45	0.00
1	スピネトラム	0.78	0.78	32.14	0.00
1	スピネトラム	0.20	0.20	33.93	0.00
1	スピネトラム	0.78	0.78	69.20	64.73
1	γ-シハロスリン	0.20	0.20	50.00	0.00
1	γ-シハロスリン	0.78	0.78	83.04	79.20
1	メトキシフェノジド	3.13	3.13	100.00	75.89
1	クロルピリホス	0.78	0.78	73.66	49.55
1	クロルピリホス	3.13	3.13	94.64	75.89
2	スピノサド	0.20	0.20	85.91	69.55
2	スピノサド	0.78	0.78	100.00	98.18
2	スピネトラム	0.20	0.20	76.36	69.55
2	γ-シハロスリン	0.78	0.78	100.00	99.77
2	メトキシフェノジド	0.05	0.78	43.18	0.00
2	メトキシフェノジド	0.20	3.13	76.36	69.55

\* Colby の式 =  $100 - ((100 - \text{化合物 A の \% 防除}) \times (100 - \text{化合物 2 の \% 防除})) / 100$  (Colby, S. R., 1967年, Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations. Weed, 15巻, 20~22頁) 【0074】

酸および塩誘導体、ならびに溶媒和物 (ACID & SALT DERIVATIVES, AND SOLVATES)

本発明に開示する化合物は、殺虫剤上許容できる酸付加塩の形態であってよい。

【0075】

非制限的な例によると、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、およびヒドロキシエタンスルホン酸との塩を形成してよい。

【0076】

さらに、非限定的な例によると、酸官能基は、アルカリまたはアルカリ土類金属に由来する塩、ならびにアンモニアおよびアミンに由来する塩を含む塩を形成してよい。好ましい陽イオンの例には、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、およびアミニウムの陽イオンが含まれる。

【0077】

10

20

30

40

50

塩は、遊離塩基の形態を、十分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する。遊離塩基の形態は、塩を、水性希NaOH、炭酸カリウム、アンモニア、および炭酸水素ナトリウムなどの適切な希塩基水溶液で処理することによって再生することができる。

## 【0078】

例として、多くの場合において、殺虫剤を修飾してより水溶性の形態にする（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、よく知られている除草剤である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）。

## 【0079】

本発明に開示する化合物は、非複合の溶媒分子を化合物から除去した後にインタクトなままである溶媒分子との安定な複合体を形成してもよい。このような複合体は、しばしば「溶媒和化合物 (solvates)」と呼ばれる。

## 【0080】

立体異性体 (STEREISOMERS)

本発明に開示するある種の化合物は、1つまたは複数の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、幾何異性体、ジアステレオマー、およびエナンチオマーが含まれる。したがって、本発明に開示する化合物には、ラセミ混合物、個々の立体異性体、および光学活性な混合物が含まれる。

## 【0081】

当業者であれば、ある立体異性体が他の立体異性体よりも活性であり得ることを理解するであろう。個々の立体異性体および光学活性な混合物は、選択的な合成手順によって、分離した出発材料を用いた従来の合成手順によって、または従来の (conventional) 分割の手順によって得ることができる。

## 【0082】

害虫 (PESTS)

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、害虫を防除することができる。

## 【0083】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、線形動物門 (Phylum Nematoda) の害虫を防除することができる。

## 【0084】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、節足動物門 (Phylum Arthropoda) の害虫を防除することができる。

## 【0085】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、鉗角亜門 (Subphylum Chelicerata) の害虫を防除することができる。

## 【0086】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、クモ綱 (Class Arachnida) の害虫を防除することができる。

## 【0087】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、多足亜門 (Subphylum Myriapoda) の害虫を防除することができる。

## 【0088】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、コムカデ綱 (Class Symphyla) の害虫を防除することができる。

## 【0089】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、六脚亜門 (Subphylum Hexapoda) の害虫を防除することができる。

## 【0090】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、昆虫綱 (Class Insecta

10

20

30

40

50

)の害虫を防除することができる。

【0091】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、甲虫目 (Coleoptera) (カブトムシ (beetles)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列举には、それだけには限定されないが、*Acanthoscelides* spp. (ゾウムシ)、*Acanthoscelides obtectus* (インゲンマメゾウムシ)、*Agriilus planipennis* (アオナガタムシ)、*Agriotes* spp. (コメツキムシ)、*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. (ウジ)、*Ataenius* *pretulus* (Black Turgrass *Ataenius*)、*Atomaria linearis* (pygmy mangold beetle)、*Aulacophore* spp.、*Bothynoderes punctiventris* (beet root weevil)、*Bruchus* spp. (ゾウムシ)、*Bruchus pisorum* (エンドウゾウムシ)、*Cacoesia* spp.、*Callosobruchus maculatus* (ヨツモンマメゾウムシ)、*Carpophilus hemipteras* (クリヤケシキスイ)、*Cassida vittata*、*Cerosterna* spp.、*Cerotoma* spp. (ハムシ)、*Cerotoma trifurcata* (bean leaf beetle)、*Ceutorhynchus* spp. (ゾウムシ)、*Ceutorhynchus assimilis* (cabbage seedpod weevil)、*Ceutorhynchus napi* (cabbage curculio)、*Chaetocnema* spp. (ハムシ)、*Colaspis* spp. (soil beetle)、*Conoderus scalaris*、*Conoderus stigmosus*、*Conotrachelus nenuphar* (スモモゾウムシ)、*Cotinus nitidis* (Green June beetle)、*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)、*Cryptolestes turcicus* (トルコカクムネヒラタムシ)、*Ctenicera* spp. (コメツキムシ)、*Curculio* spp. (ゾウムシ)、*Cyclocephala* spp. (ウジ)、*Cylindrocpturus adspersus* (sunflower stem weevil)、*Deporaus marginatus* (mango leaf-cutting weevil)、*Dermestes lardarius* (オビカツオブシムシ)、*Dermestes maculatus* (ハラジオカツオブシムシ)、*Diabrotica* spp. (ハムシ)、*Epilachna varivestis* (インゲンテントウ)、*Faustinus cubae*、*Hyllobius pales* (pales weevil)、*Hypera* spp. (ゾウムシ)、*Hypera postica* (アルファルフアタコゾウムシ)、*Hyperdoes* spp. (オサゾウムシ)、*Hypothenemus hampei* (コーヒーノミクイムシ)、*Ips* spp. (クイムシ)、*Lasioderma serricorne* (タバコシバンムシ)、*Leptinotarsa decemlineata* (コロラドハムシ)、*Liogenys fuscus*、*Liogenys suturalis*、*Lissorhoptrus oryzophilus* (イネミズゾウムシ)、*Lyctus* spp. (クイムシ/ヒラタクイムシ)、*Maecolaspis jolivetii*、*Megascelis* spp.、*Melanotus communis*、*Meligethes* spp.、*Meligethes aeneus* (blossom beetle)、*Melolontha melolontha* (common European cockchafer)、*Oberaea brevis*、*Oberaea linearis*、*Orycte*

10

20

30

40

50

s rhinoceros (date palm beetle)、Oryzaephilus mercator (オオメノコギリヒラタムシ)、Oryzaephilus surinamensis (ノコギリヒラタムシ)、Otiiorhynchus spp. (ゾウムシ)、Oulema melanopus (クビアカクビホソハムシ)、Oulema oryzae、Pantomorus spp. (ゾウムシ)、Phyllophaga spp. (May/June beetle)、Phyllophaga cuyabana、Phyllotreta spp. (ハムシ)、Phynchites spp.、Popillia japonica (マメコガネ)、Prostephanus truncates (オオコナナガシクイムシ)、Rhizopertha dominica (コナナガシクイムシ)、Rhizotrogus spp. (コフキコガネ)、Rhynchophorus spp. (ゾウムシ)、Scolytus spp. (キクイムシ)、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. (flour beetle)、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)、および Zabrus tenebrioides が含まれる。

10

20

## 【0092】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、革翅目 (Dermaptera) (ハサミムシ (earwigs)) を防除することができる。

## 【0093】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、網翅類 (Dictyoptera) (ゴキブリ (cockroaches)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、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 australoasiae (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)、および Supella longipalpa (チャオビゴキブリ) が含まれる。

30

## 【0094】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、双翅目 (Diptera) (ハエ (true flies)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、Aedes spp. (カ)、Agromyza frontella (alfalfa blotch leafminer)、Agromyza spp. (ハモグリバエ)、Anastrepha spp. (ミバエ)、Anastrepha suspensa (カリブカイミバエ)、Anopheles spp. (カ)、Batrocera 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. (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 (ダイコンタマバエ)、Delia spp.、Delia platura (タネバエ)、Drosophila spp. (ショウジョウバエ)、Fannia spp. (filth fly)、Fannia canicularis (ヒ

40

50

メイエバエ)、 *Fannia scalaris* (コブアシヒメイエバエ)、 *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* (sheep ked)、 *Musca* spp. (イエバエ)、 *Musca autumnalis* (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* (beet leafminer)、 *Phorbia* spp.、 *Psila rosae* (ニンジンサビバエ)、 *Rhagoletis cerasi* (オウトウミバエ)、 *Rhagoletis pomonella* (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)、 および *Tipula* spp. (ガガンボ) が含まれる。

【0095】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、半翅目 (Hemiptera) (true bug) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、 *Acrosternum hilare* (green stink bug)、 *Blissus leucopterus* (アメリカコバネナガカメムシ)、 *Calocoris norvegicus* (potato mirid)、 *Cimex hemipterus* (ネツタイナンキンムシ)、 *Cimex lectularius* (ナンキンムシ)、 *Dagbertus fasciatus*、 *Dichelops furcatus*、 *Dysdercus suturellus* (cotton stainer)、 *Edessa mediotabunda*、 *Eurygaster maura* (cereal bug)、 *Euschistus heros*、 *Euschistus servus* (brown stink bug)、 *Helopeltis antonii*、 *Helopeltis theivora* (tea blight plant bug)、 *Lagynotomus* spp. (カメムシ)、 *Leptocorisa oratorius*、 *Leptocorisa varicornis*、 *Lygus* spp. (メクラカメムシ)、 *Lygus hesperus* (western tarnished plant bug)、 *Macronellus hirsutus*、 *Neurocolpus longirostris*、 *Nezara viridula* (ミナミアオカメムシ)、 *Phytocoris* spp. (メクラカメムシ)、 *Phytocoris californicus*、 *Phytocoris relativus*、 *Piezodorus guildingi*、 *Poecillocapsus lineatus* (fourlined plant bug)、 *Psallus vaccinicola*、 *Pseudocysta perseae*、 *Scaptocoris castanea*、 および *Triatoma* spp. (オオサシガメ/サシガメ) が含まれる。

【0096】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、同翅目 (Homoptera) (アブラムシ (aphids)、カイガラムシ (scales)、コナジラミ (whiteflies)、ヨコバイ (leafhoppers)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、 *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 proleptella* (cabbage whitefly)、 *Aleurodicus disperses*、 *Aleurothrixus floccosus* (ウーリーコナジラミ)、 *Aluacaspis* spp.、 *Amrasca bigutella bigutella*、 *Aphrophora* spp. (ヨコバイ)、 *Aonidiella*

10

20

30

40

50

*aurantii* (アカマルカイガラムシ)、*Aphis* spp. (アブラムシ)、*Aphis gossypii* (cotton aphid)、*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* (Russian aphid)、*Brachycorynella asparagi* (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* (イセリアカイガラムシ)、*Idioscopus nitidulus* (mango leafhopper)、*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* (ムギヒゲナガアブラムシ)、*Macrosiphum rosae* (イバラヒゲナガアブラムシ)、*Macrosteles quadrilineatus* (aster leafhopper)、*Mahanarva frimbiolata*、*Metopolophium dirhodum* (rose grain aphid)、*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* (chaff scale)、*Parlatoria ziziphi* (ebony scale)、*Peregrinus maidis* (corn delphacid)、*Philaenus* spp. (アワフキムシ)、*Phylloxera vitifoliae* (grape phylloxera)、*Physokermes piceae* (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* (サンホーゼカイガラムシ)、*Rhapalosiphum* spp. (アブラムシ)、*Rhapalosiphum maidis* (corn leaf aphid)、*Rhapalosiphum padi* (oat bird-cherry aphid)、*Saissetia* spp. (カイガラムシ)、*Saissetia oleae* (black scale)、*Schizaphis graminum* (ムギミドリアブラムシ)、*Sitobion avenae* (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)、*Trialeurodes* spp. (コナジラミ)、*Trialeurodes vaporariorum* (オンシツコナジラミ)、*Trialeurodes abutiloneus* (bandedwing whitefly)、*Unaspis* spp. (カイガラムシ)、*Unaspis yanone nsis* (ヤネノカイガラムシ)、および *Zulia entreriana* が含まれる。

【0097】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、膜翅目 (Hymenoptera) (アリ (ants)、スズメバチ (wasps)、およびミツバチ (bees)) を防除することがで

10

20

30

40

50

きる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*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 minimum* (little black ant)、*Monomorium pharaonis* (ファラオアリ)、*Neodiprion* spp. (ハバチ)、*Pogonomyrmex* spp. (シュウカクアリ)、*Polistes* spp. (アシナガバチ)、*Solenopsis* spp. (カミアリ)、*Tapoinema sessile* (odorous house ant)、*Tetranomorium* spp. (pavement ant)、*Vesputula* spp. (スズメバチ)、および *Xylocopa* spp. (クマバチ) が含まれる。

10

## 【0098】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、シロアリ目 (Isoptera) (シロアリ (termites)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Coptotermes* spp.、*Coptotermes curvignathus*、*Coptotermes frenchii*、*Coptotermes formosanus* (Formosan subterranean termite)、*Cornitermes* spp. (nasute termite)、*Cryptotermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Heterotermes* spp. (desert subterranean termite)、*Heterotermes aureus*、*Kaloterme* spp. (カンザイシロアリ)、*Incisitermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Macrotermes* spp. (fungus growing termite)、*Margitermes* spp. (カンザイシロアリ)、*Microcerotermes* spp. (harvester termite)、*Microtermes obesi*、*Procornitermes* spp.、*Reticulitermes* spp. (subterranean termite)、*Reticulitermes banyulensis*、*Reticulitermes grassei*、*Reticulitermes flavipes* (eastern subterranean termite)、*Reticulitermes hageni*、*Reticulitermes hesperus* (western subterranean termite)、*Reticulitermes santonensis*、*Reticulitermes speratus*、*Reticulitermes tibialis*、*Reticulitermes virginicus*、*Schedorhinotermes* spp.、および *Zootermopsis* spp. (rotten-wood termite) が含まれる。

20

30

## 【0099】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、鱗翅目 (Lepidoptera) (ガ (moths) およびチョウ (butterflies)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Achoea janata*、*Adoxophyes* spp.、*Adoxophyes orana*、*Agrotis* spp. (ヨトウムシ)、*Agrotis ipsilon* (タマナヤガ)、*Alabama argillacea* (cotton leafworm)、*Amorbia cuneana*、*Amyelosis transitella* (navel orangeworm)、*Anacamptodes defectoria*、*Anarsia lineatella* (モモキバガ)、*Anomis sabulifera* (jute looper)、*Anticarsia gemmatalis* (velvetbean caterpillar)、*Archips argyrospila* (fruit tree leafroller)、*Archips rosana* (rose leaf

40

50

roller)、*Argyrotaenia* spp. (ハマキガ)、*Argyrotaenia citrana* (ミカンコハマキ)、*Autographa gamma*、*Bonagota cranaodes*、*Borbo cinnara* (コブノメイガ)、*Bucculatrix thurberiella* (cotton leaf perforator)、*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)、*Chrysodeixis* spp.、*Cnaphalocerus medinalis* (grass leafroller)、*Colias* spp.、*Conpomorpha cramerella*、*Cossus cossus* (carpenter moth)、*Crambus* spp. (Sod webworm)、*Cydia funebrana* (スモモヒメハマキ)、*Cydia molesta* (ナシヒメシンクイ)、*Cydia nignicana* (pea moth)、*Cydia pomonella* (コドリング)、*Darna diducta*、*Diaphania* spp. (stem borer)、*Diatraea* spp. (stalk borer)、*Diatraea saccharalis* (sugarcane borer)、*Diatraea graniosella* (southwestern corn borer)、*Earias* spp. (ワタキバガ)、*Earias insulata* (Egyptian bollworm)、*Earias vitella* (rough northern bollworm)、*Ecdytopopha aurantianum*、*Elas mopalpus lignosellus* (モロコシマダラメイガ)、*Epiphysias postruttana* (light brown apple moth)、*Ephestia* spp. (flour moth)、*Ephestia caute lla* (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* (トガリバナナセセリ)、*Eupoecilia ambiguella* (ブドウホソハマキ)、*Euxoa auxiliaris* (army cutworm)、*Feltia* spp. (ネキリムシ)、*Gortyna* spp. (stemborer)、*Grapholita molesta* (ナシヒメシンクイ)、*Hedylepta indicata* (bean leaf webber)、*Helicoverpa* spp. (ヤガ)、*Helicoverpa armigera* (オオタバコガ)、*Helicoverpa zea* (bollworm/corn earworm)、*Heliothis* spp. (ヤガ)、*Heliothis virescens* (タバコガ)、*Hellula undalis* (ハイマダラノメイガ)、*Indarbela* spp. (root borer)、*Keiferia lycopersicella* (トマトギョウチュウ)、*Leucinodes orbonalis* (ナスノメイガ)、*Leucoptera malifoliella*、*Lithocollectis* spp.、*Lobesia botrana* (grape fruit moth)、*Loxagrotis* spp. (ヤガ)、*Loxagrotis albicosta* (western bean cutworm)、*Lymantria dispar* (マイマイガ)、*Lyonetia clerkella* (キンモンホソガ)、*Mahasena corbetti* (oil palm bagworm)、*Malacosoma* spp. (テンマクケムシ)、*Mamestra brassicae* (ヨトウガ)、*Maruca testulalis* (マメノメイガ)、*Metisa plana* (ミノガ)、*Mythimna unipuncta* (true armyworm)、*Neoleucinodes elegantalis* (small tomato borer)、*Nymphula depunctalis* (rice caseworm)、*Operophtera brumata* (winter moth)、*Ostrinia nu*

*bilalis* (アワノメイガ)、*Oxydia vesulia*、*Pandemis cerasana* (ヤマトビハマキ) *Pandemis heparana* (brown apple tortrix)、*Papilio demodocus*、*Pectinophora gossypiella* (ワタキバガ)、*Peridroma spp.* (ヨトウムシ)、*Peridroma saucia* (ニセタマナヤガ)、*Perileucoptera coffeella* (white coffee leafminer)、*Phthorimaea operculella* (ジャガイモキバガ)、*Phyllocnistis citrella*、*Phyllonorycter spp.* (ハモグリムシ)、*Pieris rapae* (imported cabbage worm)、*Plathypena scabra*、*Plodia interpunctella* (ノシメダラメイガ)、*Plutella xylostella* (コナガ)、*Polychrosis viteana* (ブドウヒメハマキ)、*Prays endocarpa*、*Prays oleae* (olive moth)、*Pseudaletia spp.* (ヤガ)、*Pseudaletia unipunctata* (ヨトウムシ)、*Pseudoplusia includens* (soybean looper)、*Rachiplusia nu*、*Scirpophaga incertulas*、*Sesamia spp.* (stemborer)、*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* (シロイチモンジヨトウ)、*Spodoptera fugiperda* (fall armyworm)、*Spodoptera oridania* (southern armyworm)、*Synanthedon spp.* (root borer)、*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* (コーヒーゴマフボクトウ)、および *Zeuzera pyrina* (leopard moth)) が含まれる。

【0100】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、ハジラミ目 (Mallophaga) (ハジラミ (chewing lice)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Bovicola ovis* (ヒツジハジラミ)、*Menacanthus stramineus* (ニワトリオオハジラミ)、および *Menopon gallinea* (common hen house) が含まれる。

【0101】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、直翅目 (Orthoptera) (バッタ (grasshoppers)、イナゴ (locusts)、およびコオロギ (crickets)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Anabrus simplex* (モルモンコオロギ)、*Grylotalpidae* (ケラ)、*Locusta migratoria*、*Melanoplus spp.* (バッタ)、*Microcentrum retinerve* (angular winged katydid)、*Pterophylla spp.* (キリギリス)、*chistocerca gregaria*、*Scudderia furcata* (forktailed bush katydid)、および *Valanga nigricorni* が含まれる。

【0102】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を、シラミ目 (Phthiraptera) (シラミ (sucking lice)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Haematopinus spp.* (cattle and hog lice)、*Linognathus ovillus* (sheep lo

use)、*Pediculus humanus capitis* (アタマジラミ)、*Pediculus humanus humanus* (コロモジラミ)、および *Pthirus pubis* (ケジラミ) が含まれる。

【0103】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、ノミ目 (Siphonaptera) (ノミ (fleas)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Ctenocephalides canis* (イヌノミ)、*Ctenocephalides felis* (ネコノミ)、および *Pulex irritans* (ヒトノミ) が含まれる。

【0104】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、アザミウマ目 (Thysanoptera) (アザミウマ (thrips)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Frankliniella fusca* (tobacco thrips)、*Frankliniella occidentalis* (ミカンキイロアザミウマ)、*Frankliniella shultzei*、*Frankliniella williamsi* (corn thrips)、*Heliothrips haemorrhoidalis* (greenhouse thrips)、*Rhipiphorothrips cruentatus*、*Scirtothrips* spp.、*Scirtothrips citri* (citrus thrips)、*Scirtothrips dorsalis* (チャノキイロアザミウマ)、*Taeniothrips rhopalantennalis*、および *Thrips* spp. が含まれる。

【0105】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、シミ目 (Thysanura) (シミ (bristletails)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Lepisma* spp. (シミ) および *Thermobia* spp. (マダラシミ) が含まれる。

【0106】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、ダニ目 (Acarina) (ダニ (mites) およびマダニ (ticks)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、*Acaropsis woodi* (tracheal mite of honeybees)、*Acarus* spp. (食品ダニ)、(*Acarus siro* (コナダニ)、*Aceria mangiferae* (mango bud mite)、*Aculops* spp.、*Aculops lycopersici* (トマトサビダニ)、*Aculops pelekassi*、*Aculus pelekassi*、*Aculus schlechtendali* (リンゴサビダニ)、マダニ (*Amblyomma americanum* (アメリカアムブリオマ)、*Boophilus* spp. (マダニ)、*Brevipalpus obovatus* (privet mite)、*Brevipalpus phoenicis* (red and black flat mite)、*Demodex* spp. (ヒゼンダニ)、*Dermacentor* spp. (カタダニ)、*Dermacentor variabilis* (アメリカイヌカクダニ)、*Dermatophagoides pteronyssinus* (チリダニ)、*Eotetranychus* spp.、*Eotetranychus carpini* (yellow spider mite)、*Epitimerus* spp.、*Eriophyes* spp.、*Ixodes* spp. (マダニ)、*Metatetranychus* spp.、*Notoedres cati*、*Oligonychus* spp.、*Oligonychus coffee*、*Oligonychus ilicis* (southern red mite)、*Panonychus* spp.、(*Panonychus citri* (ミカンハダニ)、*Panonychus ulmi* (リンゴハダニ)、*Phyllocoptiruta oleivor*

10

20

30

40

50

a (citrus rust mite)、Polyphagotarsonemus latus (チャノホコリダニ)、Rhipicephalus sanguineus (クリロコイタマダニ)、Rhizoglyphus spp. (ネダニ)、Sarcoptes scabiei (ヒゼンダニ)、Tegolophus perseafloreae、Tetranychus spp.、Tetranychus urticae (ナミハダニ)、および Varroa destructor (ミツバチヘギイタダニ) が含まれる。

【0107】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、線虫類 (Nematoda) (線虫 (nematodes)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、Aphelenchoides spp. (bud and leaf & pine wood nematode)、Belonolaimus spp. (sting nematode)、Criconemella spp. (ring nematode)、Dirofilaria immitis (犬糸状虫)、Ditylenchus spp. (stem and bulb nematode)、Heterodera spp. (シストセンチュウ)、Heterodera zea (corn cyst nematode)、Hirschmanniella spp. (root nematode)、Hoplolaimus spp. (lance nematode)、Meloidogyne spp. (ネコブセンチュウ)、Meloidogyne incognita (ネコブセンチュウ)、Onchocerca volvulus (回施糸状虫)、Pratylenchus spp. (ネグサレセンチュウ)、Radopholus spp. (ネモグリセンチュウ)、および Rotylenchus reniformis (kidney-shaped nematode) が含まれる。

【0108】

別の実施形態において、本明細書に開示する本発明を用いて、コムカデ目 (Symphyla) (コムカデ (symphylans)) を防除することができる。これら害虫の非網羅的な列挙には、それだけには限定されないが、Scutigerebella immaculata が含まれる。

【0109】

より詳しい情報については、Arnold Mallis、「Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests」、第9版、著作権2004年、GIE Media社を参考にされたい。

【0110】

混合物 (MIXTURES)

本明細書に開示する本発明と組み合わせて有利に使用することができる殺虫剤のいくつかには、それだけには限定されないが、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、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アルドリン、アレスリン、アロサミジン、アリキシカルブ、シペルメトリン、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、アザディラクチン、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、シフルスリン、シペルメトリン、ピフェナザート、ピフェンスリン、ピナバクリル、ピオアレスリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、ピストリフルロン、ホウ砂、ホウ酸、ブロムフェンピンフォス、ブロモDDT、ブロモシクレン、ブロモホス、

10

20

30

40

50

ブromoホスエチル、ブromo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、  
ブタチオフォス、ブトカルボキシム、ブトネート、ブトキシカルボキシム、

カデュサフォス、硫酸カルシウム、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lorルベン  
シド、クlorルピシクレン、クlorルダン、クlorルデコン、クlorルジメフォルム、クlorルエト  
キシフォス、クlorルフェナビル、クlorルフェネトール、クlorルフェンソン、クlorルフェン  
スルフィド、クlorルフェンピンホス、クlorルフルアズロン、クlorルメホス、クlorルベンジ  
レート、クlorルホルム、クlorルメブホルム、クlorルメチウロン、クlorルピクリン、クlorル  
プロピレート、クlorルホキシム、クlorルプラゾホス、クlorルピロホス、クlorルピロホスメ  
チル、クlorルチオホス、クlorマフェノジド、シネリンI、シネリンII、シスメトリン、  
クlorエトカルブ、クlorフェンタジン、クlorサンテール、クlorチアニジン、アセト亜ヒ酸第  
二銅、ヒ酸銅(II)、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、クマホス、クミトエート、クlorタ  
ミトン、クlorトキシホス、クlorエンタレンAおよびB、クlorホメート、クlorオライト、シ  
アノフェンホス、シアノホス、シアントエート、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、シフェノトリン、シロマジン、シチオエート、

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、ジアリフォス、ジアミダホス、ジアジノン、ジカプトン、ジ  
クlorフェンチオン、ジクlorフルアニド、ジクlorルボス、ジコフォール、ジクレシル、ジク  
lorトホス、ジシクラニル、ジエルドリン、ジエノクロール、ジフロビダジン、ジフルベン  
ズロン、ジロール(dilor)、ジメフルトリン、ジメフォックス、ジメタン、ジメトエー  
ト、ジメトリン、ジメチルピンホス、ジメチラン、ジネックス、ジノプトン、ジノカップ  
、ジノカップ4、ジノカップ6、ジノクトン、ジノペントン、ジノプロップ、ジノサム、  
ジノスルフォン、ジノテフラン、ジノテルボン、ジオフェノラン、ジオキサベンゾフォス  
、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジフェニルスルフォン、ジスルフィラム、ジスルフ  
ォトン、ジチクlor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、エブリノメクチン、エスフェンバレレ  
ート、エタホス(etaphos)、エチオフェンカルブ、エチオン、エチプロール、エトエー  
トメチル、エトプロホス、エチルDDD、ギ酸エチル、エチレンジプロミド、エチレンジ  
クlorリド、エチレンオキシド、エトレンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、E  
XD、

ファミール、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lorルホス、フェネタカルブ(fenethacarb)、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、フルフェネリウム、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(fluorbenside)、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(formparanate)、ホスメチラン、ホスピレート(fospirate)、  
ホスチアゼート、ホスチエタン、ホスチエタン、フラチオカルブ、フレスリン、フル  
フラール、

シハロトリン、HCH、

ハロフェンプロックス、ハロフェノジド、HCH、HEOD、ヘブタクlorル、ヘブテノ  
ホス、ヘテロホス(heterophos)、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、HHDN、

10

20

30

40

50

ヒドラメチルノン、シアン化水素、ハイドロブレン、ヒキンカルブ (hyquincarb)、  
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  
、 I P S P、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、ジヨドフェンホス (jodfenphos)、幼若ホルモン  
I、幼若ホルモン II、幼若ホルモン III、

ケレバン、キノブレン、

シハロトリン、ヒ酸鉛、レピメクチン、レプトホス、リンデン、リリムホス (lirimfos)  
os)、ルフェヌロン、リチダチオン、

10

マラチオン、マロノベン (malonoben)、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 (methocrotophos)、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、メチルイソチオシアネート、メチルクロロホルム、塩化メチレン、メトフル  
トリン、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、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、M N A F、モ  
ノクロトホス、モルホチオン (morphothion)、モキシデクチン、

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、

20

オメトエート、オキサミル、オキシデメトンメチル、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 (phosnichlor)、ホスファミドン  
、ホスフィン、ホスホカルブ、ホキシム、ホキシムメチル、ピリメタホス、ピリミカルブ  
、ピリミホスエチル、ピリミホスメチル、亜ヒ酸カリウム、チオシアン酸カリウム、p p  
' D D T、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、プロパルギト、プロペタンホス、プロポクスール、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、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、ピリミテート (pyriminate)、ピ  
リプロール、ピリプロキシフェン、

30

カシヤ、キナルホス、キナルホス、キナルホスメチル、キノチオン、クアンティファ  
イズ (quantifies)、

ラフォキサニド、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  
(sophamide)、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、スルフラミド、スルフォテップ、イオ  
ウ、フッ化スルフルル、スルプロホス、

40

タウフルバリネート、タジムカルブ、T D E、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、テフルスリン、テメホス、T E P P、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、シベルメトリン、チアクロブリド、チアメトキサム  
、チクロホス (thicrofos)、チオカルボキシム、チオシクラム、チオジカルブ、チオフ  
ァノックス、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)  
、チューリングゲンシン (thuringiensin)、トルフェンピラド、トラロメトリン、トラン  
スフルトリン、トランスベルメトリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、

50

トリクロロホン、トリクロルメタホス3 (trichlormetaphos 3)、トリクロロナート (trichloronat)、トリフェノホス、トリフルムロン、トリメタカルブ、トリプレン、バミドチオン、バミドチオン、バニリプロール、バニリプロール、XMC、キシリカルブ、シベルメトリン、およびゾラプロホスが含まれる。

## 【0111】

さらに、上記の殺虫剤のあらゆる組合せを用いることができる。

## 【0112】

本明細書に開示する本発明を、経済上および相乗性両方の理由で、除草剤および殺真菌剤とともに用いることもできる。

10

## 【0113】

本明細書に開示する本発明を、経済上および相乗性の理由で、抗微生物剤、殺細菌剤、枯葉剤、毒性緩和剤、相乗剤、殺藻剤、誘引剤、乾燥剤、フェロモン、忌避剤、動物浸液、殺鳥剤、消毒剤、信号化学物質、および軟体動物駆除剤（これらの分類は必ずしも相互に排他的ではない）とともに用いることもできる。

## 【0114】

さらなる情報には、本明細書の出願日の、<http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>にある、「Compendium of Pesticide Common Names」を参考にされたい。C D S Tomlin編集、著作権2006年、British Crop Production Council、「The Pesticide Manual」第14版も参考にされたい。

20

## 【0115】

相乗的混合物 (SYNERGISTIC MIXTURES)

本明細書に開示する本発明を、「混合物」の表題の下に言及するものなどの他の化合物とともに用いて、混合物における化合物の作用機序が同じ、類似の、または異なる相乗的混合物を形成することができる。

## 【0116】

作用機序の例には、それだけには限定されないが、アセチルコリンエステラーゼインヒビター、ナトリウムチャンネルモジュレーター、キチン生合成インヒビター、GABAゲートドクロライドチャンネルアンタゴニスト (GABA-gated chloride channel antagonist)、GABAおよびグルタメートゲートドクロライドチャンネルアゴニスト、アセチルコリン受容体アゴニスト、METインヒビター、Mgが刺激するATPaseインヒビター、ニコチン性アセチルコリンレセプター、中腸膜ディスラプター、および酸化的リン酸化ディスラプターが含まれる。

30

## 【0117】

さらに、以下の化合物が相乗剤として知られており、本明細書に開示する本発明ととも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、プロピルイソーム (propyl isome)、セサメックス、セサモリン、およびスルホキシド。

40

## 【0118】

製剤 (FORMULATIONS)

殺虫剤は、その純粋な形態では適用にほとんど適さない。殺虫剤を必要とされる濃度および好適な形態で用いることができるように他の物質を加え、適用、取扱い、輸送、貯蔵の容易さ、および最大の殺虫作用を可能にすることが通常必要である。したがって、殺虫剤は、例えば、餌、濃縮乳剤、ダスト、乳化性の濃縮物、燻蒸剤、ゲル剤、顆粒剤、マイクロカプセル封入、種子処理、懸濁濃縮物、サスポエマルジョン、錠剤、水溶性液剤、水に分散可能な顆粒剤またはドライフロアブル、水和剤、および超小体積の溶液に製剤化される。

## 【0119】

50

製剤タイプに関するさらなる情報には、「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」、Technical Monograph、2号、第5版、CropLife International(2002年)を参照されたい。

【0120】

殺虫剤は、このような殺虫剤の濃縮製剤から調製された水性懸濁剤または乳剤として適用されることが最も多い。このような水溶性の、水に懸濁性の、または乳化性の製剤は、水和剤もしくは水に分散可能な顆粒剤として通常知られている固体、または乳化性の濃縮物もしくは水性懸濁液として通常知られている液体のいずれかである。水に分散可能な顆粒剤を形成するように凝縮されることがある水和剤は、殺虫剤、担体、および界面活性剤の均質な混合物を含んでいる。殺虫剤の濃度は、通常約10重量%から約90重量%までである。担体は、アタパルジャイト粘土、モンモリロナイト粘土、珪藻土、または純粋なケイ酸塩の中から通常選択される。約0.5%から約10%までの水和剤を含む有効な界面活性剤は、硫酸化リグニン、濃縮ナフタレンスルホネート、ナフタレンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、アルキルサルフェート、およびアルキルフェノールのエチレンオキサイド付加物などの非イオン性界面活性剤の中に見出される。

10

【0121】

殺虫剤の乳化性の濃縮物は、水混和性の溶媒、または水不混和性の有機溶媒および乳剤の混合物のいずれかである担体中に、液体1リットルあたり約50から約500グラムまでを溶解するなどの、好都合な濃度の殺虫剤を含んでいる。有用な有機溶媒には、芳香族、特にキシレンおよび石油留分、特に石油の高沸点ナフタレンおよびオレフィン部分、例えば芳香族のヘビーナフサが含まれる。他の有機溶媒、例えば、ロジン誘導体、脂肪族ケトン(例えば、シクロヘキサノン)、および複合アルコール(例えば、2-エトキシエタノール)を含むテルペンの溶媒も用いてもよい。乳化性の濃縮物に適する乳化剤は、従来の陰イオン性および非イオン性の界面活性剤から選択される。

20

【0122】

水性懸濁液は、約5重量%から約50重量%までの範囲の濃度で水性の担体中に分散している水不溶性の殺虫剤の懸濁液を含んでいる。懸濁液は、殺虫剤を細かく粉碎し、水および界面活性剤からなる担体中に勢いよく混合することによって調製される。無機塩および合成または天然のゴムなどの成分も、水性の担体の密度および粘度を増大するために加えることができる。混合水溶液を調製し、サンドミル、ボールミル、またはピストンタイプのホモジナイザーなどの器具中でホモジナイズすることによって、殺虫剤を同時に粉碎および混合するのが最も有効であることが多い。

30

【0123】

殺虫剤を、土に適用するのに特に有用である顆粒の組成物として適用してもよい。顆粒の組成物は、粘土または類似の物質を含む担体中に分散した約0.5重量%から約10重量%までの殺虫剤を通常含んでいる。このような組成物は、殺虫剤を適切な溶媒中に溶解し、約0.5mmから3mmまでの範囲の好適な粒子サイズに予め形成された顆粒の担体にそれを適用することによって通常調製される。このような組成物は、担体および化合物の生地またはペーストを作成し、押し砕き、乾燥して所望の顆粒の粒子サイズを得ることによって調合され得る。

40

【0124】

殺虫剤を含むダストは、粉末の形態の殺虫剤を、カオリン粘土、粉碎した火山岩などの適切なダスト状の農業用担体と均質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%から約10%までの殺虫剤を含むことができる。これらは種子粉衣として、または葉の適用として、ダストブロー機で適用することができる。

【0125】

好適な有機溶媒中(通常、農業化学において広く使われている、スプレーオイルなどの石油)の溶液の形態の殺虫剤を適用することは同程度に実用的である。

【0126】

50

殺虫剤を、エアロゾル組成物の形態で適用してもよい。このような組成物において、殺虫剤は、圧力発生性の噴射剤混合物である担体中に溶解または分散している。エアロゾル組成物は、そこから混合物が噴霧弁を通して分散される容器に包装される。

【0127】

殺虫剤の餌は、殺虫剤を食品もしくは誘引剤、または両方と混合する場合に形成される。害虫が餌を食べるときに殺虫剤も摂取する。餌は、顆粒、ゲル、フロアブルパウダー、液体、または固体の形態をとることができる。これらは害虫の生息場所において用いられる。

【0128】

燻蒸剤は、比較的高い蒸気圧を有し、したがって土または囲まれたスペースにおいて害虫を死滅させるのに十分な濃度のガスとして存在することができる殺虫剤である。燻蒸剤の毒性は、その濃度および暴露時間に比例する。これらは拡散能力が良好であること、および害虫の呼吸器系に浸透し、または害虫の角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、ガス密封されている部屋もしくは建物において、または特別な室において、ガスを透過しないシートのもとで、貯蔵製品害虫を防除するために適用される。

10

【0129】

殺虫剤を、様々なタイプのプラスチックポリマーに殺虫剤粒子または液滴を懸濁させることによってマイクロカプセル化してもよい。ポリマーの化学的性質を変更することによって、または処理加工における要因を変化させることによって、様々なサイズ、溶解性、肉厚、および浸透度のマイクロカプセルを形成することができる。これらの要因は、内部の有効成分が放出される速度を支配し、これは次に生成物の残留性能、作用速度、および匂いに影響を及ぼす。

20

【0130】

油剤濃縮物は、殺虫剤を溶液中に保持する溶媒中に殺虫剤を溶解することによって作成する。殺虫剤の油剤は、溶媒自体が殺虫作用を有し、外皮のロウ様の被覆の溶解が殺虫剤の取り込みの速度を増大することにより、通常、他の製剤よりも速やかに害虫を打ち倒し、死滅をもたらす。油剤の他の利点には、貯蔵安定性がより良好で、間隙への浸透がより良好で、脂肪の多い表面への付着がより良好であることが含まれる。

【0131】

別の実施形態は水中油型乳剤であり、乳剤は各々層状の液晶コーティングを備え水相に分散される油状小球を含み、各々の油状小球は農業上活性である少なくとも1つの化合物を含み、(1)少なくとも1つの非イオン性の親油性表面活性剤、(2)少なくとも1つの非イオン性の親水性表面活性剤、および(3)少なくとも1つのイオン性の表面活性剤を含む単層またはオリゴ多重層で個々にコーティングされており、小球の粒子直径の平均は800ナノメートル未満である。この実施形態に対するさらなる情報は、特許出願第11/495,228号を有する、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。使用を容易にするために、この実施形態を「O I W E」と呼ぶ。

30

【0132】

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

40

【0133】

他の製剤成分(OTHER FORMULATION COMPONENTS)

一般に、本明細書に開示する本発明を製剤において用いる場合、このような製剤は他の成分も含むことができる。これらの成分には、それだけには限定されないが(これは非網羅的で、相互に排他的ではない列挙である)、湿潤剤、展着剤(spreaders)、固着剤(s

50

tickers)、浸透剤、バッファー、金属イオン封鎖剤 (sequestering agents)、ドリフト低減剤 (drift reducing agents)、相容化剤、消泡剤、洗浄剤、および乳化剤が含まれる。少数の成分を即刻記載する。

【 0 1 3 4 】

湿潤剤は、液体に加えた場合、液体とそれが広がる表面との間の界面張力を低減することによって、液体の拡散および浸透の力を増大する物質である。湿潤剤は、農芸化学的製剤において2つの主な機能のために用いられる：処理加工および製造の間に水中の粉末の湿潤の速度を増大して可溶性液体または懸濁性濃縮物に対する濃縮物を作成するために、ならびに圧搾空気タンクにおいて生成物を水と混合する間に水和剤の湿潤時間を低下させて水分散性顆粒中への水の浸透を改善するために。水和剤、懸濁性濃縮物、および水分散性顆粒の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

10

【 0 1 3 5 】

分散剤は、粒子の表面上に吸着し、粒子の分散の状態を保存するのを助け、それらが再凝集するのを防ぐ物質である。分散剤は、製造の間の分散および懸濁を促進し、圧搾空気タンク中で粒子が確実に水中に再分散するように農芸化学的製剤に加えられる。これらは水和剤、懸濁性濃縮物、および水分散性顆粒において広く用いられる。分散剤として用いられる界面活性剤は、粒子表面上に強力に吸着し、粒子の再凝集に対する荷電した、または立体的なバリアを提供する能力を有する。最も一般的に用いられる界面活性剤は、陰イオン性の、非イオン性の、または2タイプの混合である。水和剤製剤では、最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。懸濁性濃縮物では、ナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物などの高分子電解質を用いて、非常に良好な吸着および安定化を得る。トリスチリルフェノールエトキシレートホスフェートエステルも用いられる。アルキルアリアルエチレンオキシド縮合物およびEO-POブロック共重合体などの非イオン性物質は、懸濁性濃縮物用の分散剤として陰イ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、非常に高分子量のポリマー性界面活性剤が分散剤として開発されている。これらは、非常に長い疎水性の「バックボーン」、および界面活性剤の「くし」の「歯」を形成する多数のエチレンオキシド鎖を有する。疎水性のバックボーンは粒子表面上に対して多くの繫留点を有するので、これら高分子量のポリマーは懸濁性濃縮物に非常に優れた長期間の安定性をもたらすことができる。農芸化学製剤で用いられる分散剤の例は、リグノスルホン酸ナトリウム、ナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物、トリスチリルフェノールエトキシレートホスフェートエステル、脂肪族アルコールエトキシレート、アルキルエトキシレート、EO-POブロック共重合体、およびグラフト共重合体である。

20

30

【 0 1 3 6 】

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。乳化剤がないと、2つの液体は2つの不混和性の液相に分離してしまう。最も一般的に用いられる乳化剤のブレンドは、12個またはそれを超えるエチレンオキシド単位およびドデシルベンゼンスルホン酸の油溶性のカルシウム塩とともに、アルキルフェノールまたは脂肪族アルコールを含んでいる。親水親油バランス(「HLB」)の範囲が8から18までの値であれば、通常安定性の良好な乳剤がもたらされる。乳剤の安定性は、少量のEO-POブロック共重合体の界面活性剤を加えることによって改善されることがあり得る。

40

【 0 1 3 7 】

可溶化剤(solubilizing agents)は、臨界ミセル濃度を越えた濃度の水中でミセルを形成する界面活性剤である。次いで、ミセルは、ミセルの疎水性部分の内側で水不溶の材料を溶解し、または可溶化することができる。可溶化に通常用いられる界面活性剤のタイプは非イオン性物質：モノオレイン酸ソルピタン、モノオレイン酸ソルピタンエトキシレート、およびオレイン酸メチルエステルである。

【 0 1 3 8 】

50

界面活性剤は、時に、単独で、または標的に対する殺虫剤の生物学的性能を改善するために圧搾空気タンク混合物に対する補助剤 (adjuvants) として鉱物油または植物油などの他の添加剤と一緒に、のいずれかで用いられる。バイオエンハンスメントに用いられる界面活性剤のタイプは、一般的に殺虫剤の性質および作用機序に依存する。しかし、これらは、アルキルエトキシレート、直鎖脂肪族アルコールエトキシレート、脂肪族アミンエトキシレートなど、非イオン性物質であることが多い。

【 0 1 3 9 】

農業用製剤における担体 (carrier) または希釈剤 (diluent) は、必要とされる強度の生成物をもたらすために殺虫剤に添加される材料である。担体は、通常、吸収能力の高い材料であり、希釈剤は、通常、吸収能力の低い材料である。担体および希釈剤は、ダスト、水和剤、顆粒剤、および水分散性顆粒剤の製剤で用いられる。

10

【 0 1 4 0 】

有機溶媒は、主に、乳化性濃縮物の製剤、ULV製剤において、より低い程度で顆粒剤において用いられる。溶媒の混合物が用いられることがある。溶媒の第1の主なグループは、灯油または精製パラフィン蠟などの脂肪族パラフィン油である。第2の主なグループで最も一般的なものは、キシレン、およびC<sub>9</sub>およびC<sub>10</sub>芳香族溶媒の高分子量分画などの芳香族溶媒を含んでいる。製剤を水中に乳化する場合は、殺虫剤の結晶化を防ぐための共溶媒 (cosolvents) として塩素化炭化水素が有用である。アルコールは、溶媒の強度を増大するために共溶媒として用いられることがある。

【 0 1 4 1 】

20

増粘剤 (thickeners) またはゲル化剤 (gelling agents) は、液体のレオロジーすなわち流動の性質を改変し、分散した粒子または液滴の分離および沈降を防ぐために、主に懸濁性濃縮物、乳剤、およびサスポエマルジョンの製剤において用いられる。増粘剤、ゲル化剤、および抗沈降剤 (anti-settling agents) は、概ね2つの分類、すなわち水不溶性粒子および水溶性ポリマーに分けられる。粘土およびシリカを用いて懸濁性濃縮物の製剤を生成することが可能である。これらのタイプの材料の例には、それだけには限定されないが、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、およびアタパルジャイトが含まれる。水溶性多糖は、長年、増粘 - ゲル化剤として用いられている。最も一般的に用いられる多糖のタイプは、種子および海藻の天然抽出物、または合成のセルロース誘導體である。これらのタイプの材料の例には、それだけには限定されないが、グアーゴム、ロカストビーンガム、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。他のタイプの抗沈降剤は、加工デンプン、ポリアクリレート、ポリビニルアルコール、およびポリエチレンオキシドをベースにしたものである。別の良好な抗沈降剤はキサンタンガムである。

30

【 0 1 4 2 】

微生物は調合した生成物の損傷を引き起こす。したがって、保存剤 (preservation agents) を用いてこれらの効果を除去または低減する。このような薬剤の例には、それだけには限定されないが、プロピオン酸およびそのナトリウム塩、ソルビン酸およびそのナトリウムまたはカリウム塩、安息香酸およ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、p - ヒドロキシ安息香酸メチル、および1, 2 - ベンズイソチアザリン - 3 - オン (BIT) が含まれる。

40

【 0 1 4 3 】

界面張力を低減する界面活性剤が存在すると、生成における、および圧搾空気タンクを通じた適用における混合操作の間に、水ベースの製剤に泡立ちをもたらすことが多い。泡立つ傾向を低減するために、生成段階の間に、またはボトル中に充填する前に、のいずれかに消泡剤を加えることが多い。一般的に、2つのタイプの、すなわちシリコンおよ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水性乳剤であり、非シリコンの消泡剤は、オクタノールおよびノナノール、またはシリカなどの水不溶性油である。両方の場合において、消泡剤の機能は、界面活性剤を空気 - 水界面

50

から置換することである。

【0144】

さらなる情報には、D. A. Knowles 編集、「Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations」、著作権1998年、Kluwer Academic Publishersを参照されたい。また、A. S. Perry、I. Yamamoto、I. Ishaaya、およびR. Perry、「Insecticides in Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects」、著作権1998年、Springer-Verlagも参照されたい。

【0145】

適用 (APPLICATION)

害虫の部位に適用する殺虫剤の実際の量は決定的ではなく、当業者は容易に決定することができる。一般的に、1ヘクタールあたり約0.01グラムの殺虫剤から1ヘクタールあたり約5000グラムの殺虫剤の濃度が、良好な防除をもたらすと予想される。

【0146】

それに対して殺虫剤を適用する部位は害虫が生息するあらゆる部位、例えば、野菜作物、果実および堅果をつける木、ブドウのツル、観賞植物、家畜、建物の内面または外面、および建物周囲の土であってよい。

【0147】

一般的に、餌では、餌は、例えば、シロアリが餌と接触することが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、およびハエが餌と接触することがある建物の表面（水平面、垂直面、または斜面の表面）に適用することもある。

【0148】

害虫の卵には、殺虫剤に抵抗する独特の能力のあるものがあるので、新たに現れる幼虫を防除するために繰り返し適用することが望ましいことがある。

【0149】

植物の異なる部分に殺虫剤を適用することによって、植物における殺虫剤の全体的な動きを利用して、植物の一部分の害虫を防除してもよい。例えば、葉面摂食 (foliar-feeding) の昆虫の防除は、点滴灌漑もしくは畦間散布によって、また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。種子処理は、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それから発芽するものを含めて、すべてのタイプの種子に適用することができる。代表的な例には、無脊椎動物の害虫に毒性であるタンパク質を発現するもの（例えば、*Bacillus thuringiensis* もしくは他の殺虫性の毒素）、除草剤抵抗性を発現するもの（例えば、「ラウンドアップレディー (Roundup Ready)」種子）、または殺虫性毒素、除草剤抵抗性、栄養増強、もしくはあらゆる他の有益な形質を発現する「積み重なった (stacked)」外来遺伝子を有するものが含まれる。さらに、本明細書に開示する本発明で処理した種子は、ストレスの多い成長条件により良好に持ちこた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、収穫期により高い収量を得ることができる、より健康でより活気のある植物がもたらされる。

【0150】

本明細書に開示する本発明は、獣医学の部門において、または動物の維持の分野において、内部寄生虫および外部寄生虫を防除するのに適する。本発明による化合物は、例えば、錠剤、カプセル剤、飲料、顆粒剤の形態における経口投与、例えば、浸漬、噴霧、注入、スポッティング、およびダスティングの形態における皮膚適用、および例えば注射の形での非経口投与などによる知られている様式でここに適用される。

【0151】

本明細書に開示する本発明は、ウシ、ヒツジ、ブタ、ニワトリ、およびガチョウなどの家畜の維持に有利に使用され得る。適切な製剤を、飲料水または餌と一緒に動物に経口投与する。適切である投与量および製剤は種によって決まる。

10

20

30

40

50

## 【 0 1 5 2 】

本明細書に開示する本発明は、用いることもできる。

## 【 0 1 5 3 】

殺虫剤を使用し、または市販することができる前に、このような殺虫剤は様々な（地方、地域、州、国、国際的）政府機関による冗長な評価プロセスを受ける。監督機関によって多量のデータの必要性が明記され、多量のデータの必要性は製品の登録者または製品の登録の担当の他者によるデータの生成および提出によって是正されなければならない。次いで、これらの政府機関は、このようなデータを見直し、安全性の決定が結論付けられる場合は、潜在的なユーザまたは販売者に製品の登録の認可を提供する。その後、製品の登録が承諾され支持される地方において、このようなユーザまたは販売者は、このような殺虫剤を使用し、または販売することができる。

10

## 【 0 1 5 4 】

本明細書における表題は便宜上のものにすぎず、そのあらゆる部分を解釈するために用いてはならない。

## フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 0 1 N	57/16 (2006.01)	A 0 1 N	57/16 1 0 2 B
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04
A 0 1 M	1/20 (2006.01)	A 0 1 M	1/20 A
A 6 1 K	31/44 (2006.01)	A 6 1 K	31/44
A 6 1 K	31/4436 (2006.01)	A 6 1 K	31/4436
A 6 1 P	43/00 (2006.01)	A 6 1 P	43/00 1 2 1
A 6 1 P	33/00 (2006.01)	A 6 1 P	33/00 1 7 1
A 6 1 P	33/14 (2006.01)	A 6 1 P	33/14

(74)代理人 100104282

弁理士 鈴木 康仁

(72)発明者 フアン, ジム エックス.

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 2, カーメル, オールド ミル サークル 1 5 3 8

(72)発明者 バブコック, ジョナサン エム.

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 2, カーメル, マジック スタリオン ドライブ 1 3 6 6 8

(72)発明者 ミード, トーマス

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 7 7, ジオンズビル, ハンティングトン ウッズ ポインテ 1 1 4 1

(72)発明者 ファロウ, マーク

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 7, フィッシャーズ, ピケット フェンス プレイス 1 0 8 7 0

審査官 品川 陽子

(56)参考文献 特許第4 9 7 5 0 4 6 ( J P , B 2 )

特表2 0 0 7 - 5 3 2 5 6 8 ( J P , A )

特表2 0 1 0 - 5 2 3 6 1 1 ( J P , A )

国際公開第2 0 0 8 / 0 3 0 2 6 6 ( W O , A 1 )

国際公開第2 0 0 8 / 0 2 7 0 7 3 ( W O , A 1 )

国際公開第2 0 0 7 / 1 4 9 1 3 4 ( W O , A 1 )

特表2 0 1 0 - 5 3 4 2 0 7 ( J P , A )

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 0 1 N 4 7 / 4 0

A 0 1 M 1 / 2 0

A 0 1 N 3 7 / 2 8

A 0 1 N 4 3 / 2 2

A 0 1 N 5 3 / 0 0

A 0 1 N 5 7 / 1 6

A 0 1 N 6 3 / 0 2

A 6 1 K 3 1 / 4 4

C A p l u s ( S T N )