

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3911018号

(P3911018)

(45) 発行日 平成19年5月9日(2007.5.9)

(24) 登録日 平成19年2月2日(2007.2.2)

(51) Int. Cl. F I
AO 1 N 47/02 (2006.01) AO 1 N 47/02
A 6 1 P 7/04 (2006.01) A 6 1 P 7/04

請求項の数 6 (全 9 頁)

(21) 出願番号	特願平8-529947	(73) 特許権者	バイエル・クロツプサイエンス・エス・ア ー
(86) (22) 出願日	平成8年3月27日(1996.3.27)		フランス国、エフ - 69009・リヨン、
(65) 公表番号	特表平11-503135		アブニユ・ルネ・カサン、55
(43) 公表日	平成11年3月23日(1999.3.23)	(74) 代理人	弁理士 川口 義雄
(86) 国際出願番号	PCT/EP1996/001335	(74) 代理人	弁理士 一入 章夫
(87) 国際公開番号	W01996/031123	(74) 代理人	弁理士 小野 誠
(87) 国際公開日	平成8年10月10日(1996.10.10)	(74) 代理人	弁理士 大崎 勝真
審査請求日	平成15年1月28日(2003.1.28)	(74) 代理人	弁理士 坪倉 道明
(31) 優先権主張番号	9507073.6		
(32) 優先日	平成7年4月5日(1995.4.5)		
(33) 優先権主張国	英国 (GB)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 新規な昆虫防除法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-トリフルオロメチルチオピラゾール、5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾールおよび5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾールから選択される1-フェニルピラゾール誘導体の、昆虫が移動する又は移動すると予想される表面上に適用されている乾燥薄層の形態または乾燥薄層に包埋された形態での、ゴキブリもしくはアリまたはゴキブリもしくはアリの集団に対する持続的防除を得るための使用であって、
 該層を、昆虫が直接掴んだり、咬んだり、又は食べたりすることはできないことを特徴とし、

該表面は、ガラス、セラミック、コンクリート、プラスチック表面、金属または木製表面および繊維から選択され、

該乾燥薄層が、1-フェニルピラゾール誘導体の有効量を含み、該有効量が、 100 m^2 当たり $0.01\text{ g} \sim 10\text{ g}$ であることを特徴とする、前記使用。

【請求項 2】

公共又は私的な建物又は住宅又は家財を歩いたり又は動きまわったりし得るゴキブリ又はアリの集団の防除を含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

公共又は私的な建物又は住宅又は家財を歩いたり又は動きまわったりし得るゴキブリ又はアリの集団の防除を含む請求項 1 または 2 に記載の使用であって、前記ゴキブリ又はアリが、該ゴキブリ又はアリを殺滅する領域又は該領域近くの表面を覆う薄層上又はその近くを歩く、前記使用。

【請求項 4】

ゴキブリに適用される、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 5】

前記 1-フェニルピラゾール誘導体を殺虫組成物として適用し、該殺虫組成物が 0.0001 ~ 15 % w/w の 1-フェニルピラゾール誘導体を含む、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 6】

前記殺虫組成物が、0.1 ~ 6 % w/w の前記 1-フェニルピラゾール誘導体を含む、請求項 5 に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

本発明は、公衆衛生関連の場所、即ち、ヒトが公的又は私的によく出入りする場所でゴキブリ又はアリのような昆虫を防除する新規な方法に関する。

国際特許公開 WO 87/03781 号、同 WO 93/06089 号及び同 WO 94/21606 号、ヨーロッパ特許公開第 0295117 号、同第 0403300 号及び同第 0679650 号、独国特許公開第 19511269 号、並びに米国特許第 5,232,940 号及び同第 5,236,938 号に記載されている殺虫性ピラゾールのような、殺虫活性を有する多くの化合物が公知となっている。そのような化合物をゴキブリやアリの殺滅に用いることは既に試みられているが、そのような使用は主として、餌若しくは摂取物質又は昆虫が食べると推定される食品に添加するとか、又は昆虫に直接接触させて使用するものであった。

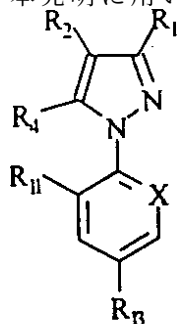
餌の使用は、ゴキブリが来ると思われる正確な場所に餌を置かなくてはならないので問題があり、また餌は子供にとって危険物となったり、有害な状況を招いたりし得る。

本発明の目的は、餌や摂取可能物質を使用せずにゴキブリ又はアリを防除する方法を提供することである。

本発明の目的は、例えば餌を用いる場合のように、昆虫自体に直接活性物質を適用することなしにゴキブリ又はアリを防除する方法を提供することである。

本発明の目的は、簡易且つ効果的なゴキブリ及びアリの防除法を提供することである。従って、本発明は、有効量の活性物質、1-フェニルピラゾール誘導体を、昆虫が接触するか又は移動する表面即ち昆虫が移動しているか若しくは移動すると予想される表面に適用することにより、ゴキブリ若しくはアリ、好ましくはゴキブリ、又はゴキブリ集団を防除する方法に関する。

本発明に用い得る 1-フェニルピラゾール誘導体は、一般に、式 (I) :



(I)

〔式中、 R_1 は CN 又はメチルであってよく；

R_2 は $S(O)_n R_3$ であってよく；

R_3 はアルキル又はハロアルキルであってよく；

R_4 は、水素若しくはハロゲン原子；又は $NR_5 R_6$ 、 $S(O)_m R_7$ 若しくは $C(O)O-$

10

20

30

40

50

R_7 、アルキル、ハロアルキル若しくは OR_8 ラジカル；又は $-N=C(R_9)(R_{10})$ ラジカルを表し；

R_5 及び R_6 は独立に、水素原子若しくはラジカルアルキル、ハロアルキル、 $C(O)$ アルキル若しくは $S(O)_rCF_3$ であるか、又は、 R_5 と R_6 が一緒になって、1個以上の二価のヘテロ原子、例えば酸素若しくは硫黄で遮断され得る二価のアルキレンラジカルを形成し得；

R_7 はアルキル又はハロアルキルラジカルであってよく；

R_8 はアルキル若しくはハロアルキルラジカル、又は水素原子であってよく；

R_9 は水素原子又はアルキルラジカルであってよく；

R_{10} は、場合によって、1個以上のハロゲン原子又は1個以上の基、例えば、 OH 、 $-O$ アルキル、 $-S$ アルキル、シアノ又はアルキルで置換されたフェニル又はヘテロアリール基であってよく、

R_{11} 及び R_{12} は独立に、水素又はハロゲン原子を表し；

R_{13} は、ハロゲン原子、又はハロアルキル、ハロアルコキシ、 $S(O)_qCF_3$ 若しくは SF_5 基を表し、

m 、 n 、 q 、 r は独立に、0、1又は2に等しい整数であってよく；

X は、三価の窒素原子又は $C-R_{12}$ ラジカル（ここで、炭素原子の3つの残りの遊離結合は芳香族環の一部である）を表し；

但し、 R_1 がメチルのとき、 R_3 はハロアルキル、 R_4 は NH_2 、 R_{11} は Cl 、 R_{13} は CF_3 、 X は N である〕の化合物である。

式(I)のアルキル又はアシル基は、低級アルキル又はアシル、即ち、1～4個の炭素原子を有するラジカルであるのが好ましい。

式(I)の化合物の好ましいクラスは、 R_1 が CN 且つ／又は R_3 がハロアルキル且つ／又は R_4 が NH_2 であってよく且つ／又は R_{11} 及び R_{12} が独立にハロゲン原子であり、且つ R_{13} がハロアルキルであってよい式(I)の化合物を包含する。

本発明に用い得るさらに別の好ましい活性成分は、 R_{11} 及び R_{12} が塩素、 R_3 及び R_{13} がトリフルオロメチル、 R_5 がアミノである式(I)の化合物である。

そのような殺虫剤のうちで最も好ましいのは、5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル)フェニル-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール（以後化合物Aと称する）、5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル)フェニル-4-トリフルオロメチルチオピラゾール（以後化合物Bと称する）、5-アミノ-3-シアノ-1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル)フェニル-4-トリフルオロメチルスルホニルピラゾール（以後化合物Cと称する）である。

本発明において、活性成分は薄層の形態であるか又は薄層中に包埋されており、且つ該薄層は、昆虫が接触、移動若しくは歩いている表面、又は昆虫が歩くであろう表面、歩いていると予想されるか若しくは歩いていると推定される表面の全体又は一部を覆っているものと理解されたい。この薄層のために、昆虫は、式(I)の成分を含む離散量の組成物を直接掴んだり、咬んだり、又は食べたりすることはできない。ここに本発明の進歩性がある。

本発明の他の態様は、昆虫が掴むことはできないが、殺虫上有効量の活性成分が処理すべき領域の表面に拡張していることにより、公的又は私的住宅、建物、家庭又は家の中を歩いたり又は動きまわったりし得るゴキブリ又はアリの集団を防除する方法を提供する。

本発明の他の態様は、ゴキブリ又はアリが歩くと推定される表面を薄層で覆うことにより、公的又は私的住宅、建物、家庭又は家の中を歩いたり又は動きまわったりし得るゴキブリ又はアリの集団を防除する方法を提供する。

本発明の他の態様は、ゴキブリ又はアリが殺されるべき領域又は該領域近くの表面を覆っている薄層上を該昆虫に歩かせることにより、公的又は私的住宅、建物、家庭又は家の中を歩いたり又は動きまわったりし得るゴキブリ又はアリの集団を防除する方法を提供する。

10

20

30

40

50

好ましく且つ最も効果的な実施態様によれば、本発明は特にゴキブリに適用される。
本発明の方法は、好ましくは液体配合物を適切な表面に噴霧することにより、活性成分の適用が極めて容易であるという点で特に有利である。

本発明により処理される表面は、滑らかであってもざらざらしていてもでこぼこであってもよいが、滑らかな表面が最も効果的である。多様な表面、例えば、ガラス、セラミックス、コンクリート；ビニルプラスチック、メラミン、リノリウムのようなプラスチック表面；家具のような金属又は木製表面；布のような繊維を用い得る。

本発明の活性成分をデポジットさせた層は、適用直後には湿っていても、乾燥してもよいが、適用してから数時間後には乾燥状態になる。該層は、あらゆる公知被覆法により、例えば、スプレーコート、ペイント、ディップ、洗浄液、浸漬液、ラッカー、フォーム、微粉、粉末、ペースト、クリーム、水和剤、エアゾール、乳剤、濃縮懸濁液、流動性懸濁液、水性懸濁液、油性懸濁液、油溶液、エアゾールパック（pressure pack）又は当業者には周知の他の標準的化合物として形成し得る。

式（I）の活性成分を含む組成物、特に液体組成物は、上記に引用した従来技術に既に記載されている。

いわゆるワモンゴキブリ（*Periplaneta americana*）だけでなくチャバネゴキブリ（*Blattella germanica*）のような他のゴキブリをも防除するための公的住宅又は建物の公衆衛生としてのゴキブリ処理が本発明の好ましい特徴である。

従って、本発明は、ゴキブリ又はアリが接触するか又は接触すると推定される表面に式 I の化合物を適用することを含む、ゴキブリ又はアリの防除法を提供する。該化合物は薄層として適用するのが好ましい。

式（I）の化合物は、上記に引用した特許文献に記載のいずれの方法によっても製造し得るし、化学合成の当業者には公知の他の方法に従って製造することもできる。

本発明に用い得る有効組成物は、種々の量で提供又は提示し得る。通常、 100 m^2 当たり、 $0.0001\sim 20\text{ g}$ 、好ましくは $0.01\sim 10\text{ g}$ の量の式（I）の化合物を含む活性組成物を用いるのが有利である。

本発明に有用であり（且つゴキブリ又はアリの防除のために表面を覆う）組成物は、一般に、 $0.0001\sim 15\text{ \% w/w}$ 、好ましくは $0.1\sim 6\text{ \% w/w}$ の活性成分を含む。該組成物は、投与前には液体形態、特に、乳化性濃縮物、水性エマルジョン、濃縮懸濁液又は流動性懸濁液の形態であり得る。しかし、該液体は乾燥後に薄層の形態となる。

該殺虫組成物は、あらゆる種類の相溶性界面活性剤及び／又は担体をも含み得る。付着剤、色素、皮膜形成剤などのようなアジュバントを用いてもよい。担体そのものは固体でも液体でもよい。

式（I）の化合物は、順次又は混合して、特に別の農薬、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤又は殺真菌剤と混合して用い得る。

該組成物は、諸成分を混合して製造し得る。

本発明を以下の実施例により説明するが、本発明は該実施例により制限又は限定されるものではない。

実施例 1

化合物 A と化合物 B をアセトン／水混合物に溶解し、ガラス上にデポジットさせ、一晚放置して乾燥させた。観察の結果は以下の通りであった：

10

20

30

40

化合物	用量レベル mg/100m ²	ゴキブリを導入してから 90分後の死亡率(%)	ゴキブリを導入してから 18時間後の死亡率(%)
B	125	100	100
B	31	100	100
B	10	0	91
A	125	100	100
A	31	100	100
A	10	5	100

10

実施例 2

化合物 A を、3 種の組成物：(i) 乳化性濃縮物（EC — 湿展剤及び有機溶媒）；(ii) 水性エマルジョン（EW — 湿展剤＋水＋有機溶媒）；及び (iii) 濃縮懸濁液（SC — 分散剤及び水）中に液体配合物 1 リットル当たり 12.5 g の量で配合した。各配合物を水に溶解し、

(Méthode C. E. B. No. 159 Chapitre II / §1, "Méthode d'essai d'efficacité pratique de spécialités insecticides destinées à la destruction des blattes dans les locaux Novembre 1992, " paragraph 2.6.

20

30

に記載のように) ペイントしたセメント及びプラスチック製フローリングの試料上にデポジットさせて、125mg/100m²、500mg/100m²及び1,250mg/100m²のデポジット層を得た。2～15日齢の *Blattella germanica* (チャバネゴキブリ) を該表面上に4時間置いてから取り出し、処理を施していないジャーに入れ、ジャーに入れてから96時間後に観察した。各処理を3回繰り返した。観察の結果は以下の通りであった。死亡率は、供試した昆虫中の死んだ昆虫の百分率として記録する。

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	10.2	100
EC/500mg/100m ²	100	100
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	93.3	100
EW/500mg/100m ²	88	95.7
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	93.3	100
SC/500mg/100m ²	67.7	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

40

50

実施例 3

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 24 時間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであった：

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	14	100
EC/500mg/100m ²	100	100
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	49	100
EW/500mg/100m ²	74	100
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	43	100
SC/500mg/100m ²	100	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

10

実施例 4

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 14 日間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであった：

20

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	13.6	100
EC/500mg/100m ²	100	100
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	37.7	100
EW/500mg/100m ²	77.7	100
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	44.3	100
SC/500mg/100m ²	100	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

30

実施例 5

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 30 日間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであった：

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	6.7	72.3
EC/500mg/100m ²	100	100
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	53.3	100
EW/500mg/100m ²	82.3	100
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	51	100
SC/500mg/100m ²	100	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

10

実施例 6

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 90 日間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであった：

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	8.9	24.3
EC/500mg/100m ²	95.7	100
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	69	100
EW/500mg/100m ²	95.7	100
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	84.3	100
SC/500mg/100m ²	100	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

20

30

実施例 7

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 120 日間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであった：

配合物/用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC/125mg/100m ²	4.3	8.8
EC/500mg/100m ²	95.7	97.7
EC/1,250mg/100m ²	100	100
EW/125mg/100m ²	69	100
EW/500mg/100m ²	88.7	100
EW/1,250mg/100m ²	100	100
SC/125mg/100m ²	86.7	100
SC/500mg/100m ²	100	100
SC/1,250mg/100m ²	100	100

40

実施例 8

実施例 2 のプラスチック製フローリングとセメントの試料を暗所で 180 日間 25℃ に保持した。実施例 2 のゴキブリの配置と観察を繰り返した。観察の結果は以下の通りであっ

50

た：

配合物／用量	プラスチック上の死亡率 (%)	セメント上の死亡率 (%)
EC／125mg／100m ²	0	0
EC／500mg／100m ²	100	100
EC／1,250mg／100m ²	100	100
EW／125mg／100m ²	60	100
EW／500mg／100m ²	93.3	100
EW／1,250mg／100m ²	100	100
SC／125mg／100m ²	24.4	75.5
SC／500mg／100m ²	100	100
SC／1,250mg／100m ²	100	100

10

実施例 9

多孔性コンクリートに、化合物 B の 20 ppm (アセトン／水) 溶液を含浸させ、ゴキブリ (*Blattella germanica*) に該コンクリートの表面を歩かせた。処理後 1 日目には、昆虫の 50 % が死亡したことが観察された。

フロントページの続き

(72)発明者 ツウイン, デイビッド・チャールズ
イギリス国、エセツクス・シー・エム・5・0・エイチ・ダブリュ、オンガー、ファイフイールド
・ロード、リサーチ・ステーション・オブ・ローヌープーラン・アグリカルチャー (番地なし)

審査官 富永 保

(56)参考文献 特開平07-070077 (JP, A)
特開平05-086054 (JP, A)
特開平03-002160 (JP, A)
特開昭64-066169 (JP, A)
特開昭63-316771 (JP, A)
特開昭61-268671 (JP, A)
特開平07-173021 (JP, A)
特開平08-175910 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
A01N 43/56
A01N 47/02