

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5717034号
(P5717034)

(45) 発行日 平成27年5月13日 (2015. 5. 13)

(24) 登録日 平成27年3月27日 (2015. 3. 27)

(51) Int. Cl.		F I			
AO1N 43/90	(2006.01)	AO1N	43/90	101	
AO1P 5/00	(2006.01)	AO1P	5/00		
AO1N 25/12	(2006.01)	AO1N	25/12		
AO1N 25/04	(2006.01)	AO1N	25/04	101	

請求項の数 3 (全 15 頁)

(21) 出願番号	特願2012-199862 (P2012-199862)	(73) 特許権者	593182923 丸和バイオケミカル株式会社 東京都千代田区神田須田町2丁目5番2号
(22) 出願日	平成24年8月27日 (2012. 8. 27)	(72) 発明者	川田 弘志 東京都千代田区神田須田町二丁目5番2号 丸和バイオケミカル株式会社内
(65) 公開番号	特開2014-43431 (P2014-43431A)	審査官	村守 宏文
(43) 公開日	平成26年3月13日 (2014. 3. 13)		
審査請求日	平成25年6月19日 (2013. 6. 19)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 マクロライド系化合物を含有する土壌線虫防除用薬剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

8重量%以上の16員環マクロライド系化合物、および界面活性剤を26重量%以上含み、かつ沸点150 以上の水溶性溶剤を26重量%以上含有する水希釈時に澄明な土壌線虫防除用乳剤。

【請求項2】

前記16員環マクロライド系化合物がアバメクチン(abamectin CAS NO. 71751-41-2)、イベルメクチン(ivermectin CAS NO. 70288-86-7)、エプリノメクチン(eprinomectin CAS NO. 123997-26-2)、ドラメクチン(doramectin CAS NO. 117704-25-3)、モキシデクチン(moxidectin CAS NO. 113507-06-5)のいずれかである請求項1に記載する土壌線虫防除用乳剤。

【請求項3】

請求項1、または請求項2に記載する乳剤を含有し、かつ使用する鉱物担体の粒子径が63 μmから1000 μmである粒状の土壌線虫防除用薬剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、農作物に寄生する土壌線虫の防除技術に関する。

【背景技術】

【 0 0 0 2 】

農作物は、一年生の作物から果樹に至るまで普遍的に植物寄生線虫の被害を受けている。植物寄生線虫から作物の被害を防ぐためには、線虫の被害を受けにくい品種を選抜して作付する、施肥によって収穫量の減少を抑制する、同一作物の連作を避け特定の植物に寄生する線虫の被害を回避する等の技術が用いられている。

【 0 0 0 3 】

しかし、集約的な栽培を行う一年生の野菜類等は連作を余儀なくされ、線虫からの被害を免れることは難しく化学的な防除が行われている。土壌内に生息する線虫を防除するには、薬剤が三次元的に拡散することが求められる。従って、ガス化して拡散する燻蒸剤、もしくは水溶性の高い有機リン系化合物やカーバメイト系化合物が使用されている。毒性が高い有機リン系化合物やカーバメイト系化合物は、安全性が確保でき、使いやすい粒剤に調製して土壌に混和する方法が普及している。

10

【 0 0 0 4 】

16員環マクロライド系化合物は、節足動物、線形動物に対する高い殺虫活性を有しており、人を含む動物の駆虫薬、および農業用の殺虫剤、殺ダニ剤として世界で広く使用されている抗生物質起源の一系統である。我が国では、エマメクチン安息香酸塩 (emamectin CAS NO. 155569-91-8) 1%がアファーム乳剤として、ミルベメクチン (milbemectin CAS NO. 51596-10-2、CAS NO. 51596-11-3) 1%がコロマイト乳剤として、レピメクチン (lepimectin CAS NO. 171249-05-1、CAS NO. 171249-10-8) 1%がアニキ乳剤として農業用の殺虫、殺ダニを目的に使用されている。また、エマメクチン、ミルベメクチン、およびネマデクチン (nemadectin CAS NO. 102130-84-7 3.6% 製品名メガトップ液剤) はマツノザイセンチュウ防除用薬剤として使用されている。その他、イベルメクチン (ivermectin CAS NO. 70288-86-7)、エプリノメクチン (eprinomectin CAS NO. 123997-26-2)、セラメクチン (selamectin CAS NO. 165108-07-6)、ドラメクチン (doramectin CAS NO. 117704-25-3)、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime CAS NO. 129496-10-2)、モキシデクチン (moxidectin CAS NO. 113507-06-5) が動物用駆虫薬として使用されている。アメリカ合衆国、およびその他の国においてアバメクチン (abamectin CAS NO. 71751-41-2) の46.3%懸濁剤 (商品名AVICTA 500FS) が綿、大豆、トウモロコシの土壌線虫防除用種子処理剤として実用化されている。

20

30

【特許文献1】EP 1922930 A2

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 0 5 】

ガス化による拡散を期待できない化合物による土壌線虫防除は、耕運や灌水、雨水による土壌内への混和や拡散が不可欠である。しかし、一方において薬剤散布による必要領域外への飛散、もしくは灌水や雨水に伴う地下浸透による漏洩を避けることも重要な課題である。線虫類のみならず、多くの節足動物等に対し極めて低い濃度で影響を与える16員環マクロライド系化合物を作物に寄生する土壌線虫防除に応用する場合、飛散漏洩は大きな問題となるが、土壌線虫の防除は薬剤を三次元的に土壌内に拡散させることが不可欠であるため、単位面積あたりの薬剤使用量が大きくならざるを得ない根本的な問題を有している。

40

【 0 0 0 6 】

線虫の駆除、防除に係わる16員環マクロライド系化合物の総説がアメリカ合衆国線虫学会から報告されている (非特許文献1)。そこには、アバメクチンおよびその関連化合物を含むアベルメクチン類 (avermectins) の土壌線虫に対する作用性、化学

50

構造との活性相関を始め、作物、処理方法など多様な角度からの検討結果が示され、アベルメクチン類の植物寄生線虫に対する非常に高い効果を認めると同時に、土壤線虫の生育環境との対応が難しい物理化学性状、例えば水溶解度が極めて低いこと、また多くの土壤型で移行性が悪いことから今後検討すべき技術的な課題が示されている。ここに引用されたアバメクチン粒剤の有機リン系化合物やカーバメイト系化合物の粒剤との比較（非特許文献2）は、低い有効成分濃度ながら有機リン系化合物やカーバメイト系化合物の粒剤と比較して土壤線虫防除能力がやや劣ることが記されている。また、アバメクチン乳剤を使用した土壤線虫防除試験は、砂土における効果は認められるものの有機物含有量の高い土壤では防除が困難としている（非特許文献3）。現在まで、16員環マクロライド系化合物による土壤線虫の防除用技術は、アバメクチンの懸濁製剤を用いた種子消毒による主根の被害を防ぐ方法を除き確立されていない。

10

【非特許文献1】Joseph A. Veech, Donald W. Dickson. Society of Nematologists. 1987. VISTAS ON NEMATOLOGY, Chapter 20, 136 - 146

【非特許文献2】Nordmeyer, D., and D. W. Dickson. 1985. Plant Disease 69: 67 - 69

【非特許文献3】Jean-Claude Cayrol, Caroline Djian and Jean-Pierre Frankouski. Fundam. appl. nematol., 1993, 16(3), 239 - 246

【0007】

20

16員環マクロライド系化合物は、分子量が大きく疎水的であり、水に対する溶解度は、アバメクチン1.21mg/L、エマメクチン安息香酸塩24mg/L、ミルベメクチン0.88mg/Lであり、わが国で使われている有機リン系土壤線虫剤であるホスチアゼート（fosthiazate CAS NO. 98886-44-3）9.85g/Lやイミシアホス（imicyafos CAS NO. 140163-89-9）77.6g/L、またカーバメイト系土壤線虫剤であるオキサミル（oxamyl CAS NO. 23135-22-0）280g/Lに比較して非常に低い。また、アバメクチンは土壤吸着が非常に強く、土壤微生物による分解が早いとされ（非特許文献4）、日本の畑作で広く使われている有機物含有量が5%以上とされる洪積世火山灰土壤に適用する場合、有効成分を均一に拡散させることは困難であると推測される。以上のような土壤線虫に対する既往の防除試験結果と環境生物に対する安全性、強酸、強塩基による加水分解、光によって速やかに分解する物理化学的な性状を考慮すれば、16員環マクロライド系化合物を用いる土壤線虫防除は、新しい技術の開発が求められている。

30

【非特許文献4】C D S Tomlin The Pesticide Manual Fifteenth Edition British Crop Protection Council 2009 3 - 4

【課題を解決するための手段】

【0008】

本発明者はこれまで高い基礎活性を持ちながら土壤線虫の防除薬剤として広く実用に供することのできなかつた16員環マクロライド系化合物の安全かつ簡便な使用方法について検討を続けてきた。その結果、自然水の中にあっても安定なミセルを維持しながら速やかに処理領域内を拡散しうる乳剤、もしくはその乳剤の水希釈液を土壤表面に散布後に土壤と混和する、もしくは比重の大きな鉱物粒子に本乳剤を付着させて土壤表面に散布後に土壤と混和することによって使いやすく、かつ飛散のない土壤線虫防除技術を完成させた。

40

【0009】

本発明に係る粒剤の調製は、水溶性有機溶剤を主溶剤とする有機溶剤および界面活性剤に溶解させた16員環マクロライド系化合物の乳剤を攪拌中の鉱物担体に滴下もしくは噴霧させることによって容易に製造できる。

【0010】

50

本発明に関わる代表的な16員環マクロライド系化合物としてはアバメクチン、イベルメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、モキシデクチンがあげられるがこれらに限定されるものではない。

【0011】

アバメクチンによる土壌線虫防除の場合、必要な有効成分量は、非特許文献2に記載される有機リン系、もしくはカーバメイト系殺線虫剤に比べて効果が劣るとする有効成分量0.17kg/ha、および非特許文献3において砂土で効果が認められる一方、有機物含有量の高い土壌では検討が必要と明記される有効成分量である40mg/m²とほぼ同量からやや多い10a当たり20gから60gである。

【0012】

本発明に係る16員環マクロライド系化合物の乳剤を調製するには、有効成分を溶解しうる溶剤および乳化するための界面活性剤が必要である。一方、分子量が大きい16員環マクロライド系化合物は、溶剤に対する溶解性が低く、高い極性を有する溶剤以外に高濃度乳剤の調製は困難である。

【0013】

一般的な乳剤は水に難溶性の有機溶剤に有効成分を溶解し界面活性剤を混合して調製される。水溶性の極性溶剤を用いた場合、水溶解度の低い有効成分は、溶剤の水への移行に伴って成分の分離を生ずる。また、可視光線の波長以下の澄明なエマルションは白濁したエマルションに比べてミセルの安定性が高いことが知られており、水を主溶剤とするマイクロエマルション製剤が知られている。しかし、使用する原材料価格が高くなること、また加水分解しやすい物質には不適であり、製品安定性を維持するとともに水で希釈した散布液の安定性を維持する課題もあって商品化の難しい技術とされている。

【非特許文献5】日本農薬学会 農薬製剤・施用法研究会編 農薬製剤ガイド 1997
社団法人 日本植物防疫協会

【0014】

本発明における乳剤の調製に用いる溶剤は、有効成分の溶解性能が高いことが必要不可欠である。同時に、製造上の安全性と本乳剤を付着させた粒剤の安定性を保つため、高い沸点を有する極性溶剤が望ましい。例えば、ジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン、N-エチルピロリドン、エチレングリコール、ジエチレングリコール、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、トリプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、乳酸エチル等、150以上の沸点を持つ水溶性の極性溶剤が好ましい。特に溶解能力と安全性からジメチルスルホキシドが好ましい。その他、難水溶性の高沸点極性溶剤、高沸点芳香族系溶剤等を水溶性極性溶剤と併用することも可能であるが、その混合溶剤は有効成分を十分溶解しうる必要がある。

【0015】

界面活性剤は、水中で安定なミセルを形成し、土壌水の移動と共に有効成分を速やかに拡散させる機能を有する。ミセルの安定化には陰イオン系界面活性剤と非イオン系界面活性剤を併用する方法が一般的であり、乳剤として多くの界面活性剤が利用されている。例えば、陰イオン系界面活性剤としては、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ジアルキルスルホサクシネート、ポリオキシアルキレンアリルフェニルエーテルサルフェート、ポリオキシアルキレンアリルフェニルエーテルホスフェート、アルキルリン酸塩等があげられる。また、非イオン系界面活性剤としては、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ジポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンアリルフェニルエーテル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等があげられる。

本発明製剤に使用する陰イオン系界面活性剤と非イオン系界面活性剤の総量は、20重量%から70重量%であり、好ましくは30重量%から50重量%である。

【0016】

乳剤を用いて直接線虫を防除する場合、例えば下記試験例3、表9-2に示すごとく、調製した乳剤を水で希釈して土壌表面に散布後、混和すればよい。ただし、土壌表面への灌注処理では下層部への薬剤の拡散が困難であり土壌線虫の防除は難しい。また、土壌に混和する場合においても、土壌の水分含有量が過度に高い場合は土壌への均一な混和が妨げられることがあり注意が必要である。

【0017】

粒剤の調製は一般に、クレーにモンモリロナイト系鉱物の微粉を加えて有効成分と共に練り込んで造粒乾燥する。もしくは有効成分を、吸油能を持つモンモリロナイト系鉱物の造粒乾燥品や、篩い分けした天然鉱物由来で吸油能の高いアタパルジャイト、軽石、焼成珪藻土、ゼオライト、パーライト等の担体に含浸させる方法、もしくは珪石や炭酸カルシウム等吸油能を持たない担体に水溶性の糊料を使って固着させる方法が用いられている。

10

【0018】

水溶解度の低い16員環マクロライド系化合物を有効成分とする場合は、高濃度の乳剤を調製して、珪石、炭酸カルシウム等、比重が大きくて飛散抑制が可能な鉱物担体の表面に付着させる方法が望ましい。粒剤の粒子径は微細なほど混和時における土壌内有効成分の分布が均一化して効果の安定をもたらすことができる。しかし、一方で飛散による環境生物への影響を考慮すれば、我が国における飛散抑制型散布用製剤である微粒剤F（粒径範囲63 μ mから212 μ m）の下限粒径である63 μ mから、粒剤（300 μ mから1700 μ m）の中位粒径である1000 μ mが望ましい。粒剤を調製するに当たって水溶性の固着剤を用いることも可能であるが、粘度の高い乳剤であればそのまま鉱物担体に付着させることも可能である。この時、均一で剥落のない付着を図るためには、乳剤中の有効成分濃度は5重量%から20重量%が望ましい。我が国において一般的な粒状線虫防除剤の土壌混和处理方法である10a当たり20kgを基準に考えれば、16員環マクロライド系化合物粒状製剤の場合、有効成分濃度を0.1重量%から0.3重量%に調製する。

20

【0019】

吸油能が低く粒子間で固着しやすい担体の場合は、多孔質珪酸等の微粉を0.5重量%から1.5重量%添加することによって防止することができる。

【0020】

なお、16員環マクロライド系化合物は酸化反応を受けやすく、製品の経時安定性を保つために酸化防止剤が常用される。例えば、アメリカ合衆国で食品添加物に認可されているジブチルヒドロキシトルエン（BHT）を使用する場合は、0.0002重量%から0.5重量%を製品に添加する。

30

【発明の効果】

【0021】

環境生物に対して極低濃度で影響を与える16員環マクロライド系化合物を、処理領域外への飛散や漏洩なく土壌の処理領域内に均一に拡散させ、作物に有害な土壌線虫の防除を可能にする。

【発明を実施するための最良の形態】

【0022】

発明の実施の形態を製剤例に基づき説明する。

40

【0023】

なお、以下の表中に示す記号は下記（）内の有効成分、界面活性剤、溶剤を表す。

（有効成分）

A B A（アバメクチン）、D O R（ドラメクチン）、E M A（エマメクチン）

E P R（エプリノメクチン）、I V E（イベルメクチン）、L E P（レピメクチン）

M I L（ミルベメクチン）、M O X（モキシデクチン）、N E M（ネマデクチン）

S E L（セラメクチン）

（界面活性剤）

N A 4 1 B（アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム）

50

製品名 ニューカルゲン A - 4 1 B 竹本油脂株式会社)	
N E P 7 0 G (ジアルキルスルホサクシネート	
製品名 ニューカルゲン E P - 7 0 G 竹本油脂株式会社)	
N F S 7 0 0 G (ポリオキシアルキレンアリルフェニルエーテルサルフェート	
製品名 ニューカルゲン F S - 7 0 0 G 竹本油脂株式会社)	
S O L T 1 5 S (ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテルサルフェート	
製品名 ソルポール T 1 5 - S P G 東邦化学工業株式会社)	
N C P 1 2 0 (ポリオキシアルキレンアリルフェニルエーテル	
製品名 ニューカルゲン C P - 1 2 0 竹本油脂株式会社)	
S O L T 1 5 (ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル	10
製品名 ソルポール T - 1 5 東邦化学工業株式会社)	
S 4 6 5 (ジポリオキシエチレンアルキルエーテル	
製品名 サーフイノール 4 6 5 日信化学工業株式会社)	
S O L 3 0 8 0 (ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、アルキルアリルスルホネート混合物	
製品名 ソルポール 3 0 8 0 東邦化学工業株式会社)	
S O L 3 8 8 0 (ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテルホルムアルデヒド縮合物、アルキルベンゼンスルホン酸カルシウム混合物	
製品名 ソルポール 3 8 8 0 東邦化学工業株式会社)	
(溶剤)	
A M D 8 1 0 (炭素数 8 ~ 1 0 の脂肪酸ジメチルアミド C o g n i s G m b H 社	20
製品)	
B L (乳酸ブチル P U R A C b i o q u i m i c a s a 社商品)	
E L (乳酸エチル 株式会社武蔵野化学研究所商品)	
D E G B E (ジエチレングリコールモノブチルエーテル 和光純薬株式会社商品)	
D M S O (ジメチルスルホキシド 東京化成工業株式会社商品)	
D P G (ジプロピレングリコール 和光純薬株式会社商品)	
2 E H X (2 - エチルヘキサノール キシダ化学株式会社商品)	
N M P (N - メチルピロリドン キシダ化学株式会社商品)	
P P G 4 0 0 (ポリプロピレングリコール M W 4 0 0 和光純薬工業株式会社商品)	
S F 0 2 (芳香族系炭化水素	30
製品名 カクタスファイン S F - 0 2 株式会社ジャパンエナジー)	
【 0 0 2 4 】	
(製剤例 1) アバメクチン乳剤の調製 その 1	
アバメクチン (和光純薬工業株式会社商品 純度 9 6 %) 4 0 m g、もしくは 5 3 m g に下記の溶剤、および界面活性剤を加えて 5 0 0 m g の乳剤を調製した。この 5 0 μ l を水道水 (硬度約 7 0) 5 0 m l に希釈して希釈時の状態、および 2 2 に静置して経時的な沈殿の析出状態を 4 日間観察した。その成分組成と沈殿の析出状態を表 1 - 1、表 1 - 2、および表 1 - 3 に示す。	
以下の試験における沈殿の析出状態は下記の通り評価した。	
- 全く沈殿を認めない。 ± 極僅かに沈殿を認める。	40
+ 沈殿を認める。 ++ 明らかな沈殿を認める。	
【 0 0 2 5 】	

【表 1 - 1】

右：製剤番号 下：成分重量	NO.1	NO.2	NO.3	NO.4	NO.5	NO.6	NO.7	NO.8
ABA	40	40	40	40	40	40	40	40
SOL3080	130	180	230	230	180	180	230	180
PPG400	75	75		75	75	75		75
DMSO	255	205	230	155	155	105	130	55
BL					50	100	100	150
合計	500	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明
経過時間	上記乳剤希釈液の沈殿析出状態							
2時間後	-	-	-	-	-	-	-	-
8時間後	-	-	-	-	-	-	-	-
1日後	-	-	-	-	-	-	-	-
4日後	±	±	-	±	±	±	±	±

10

【0026】

【表 1 - 2】

右：成分組成 下：成分重量	NO.9	NO.10	NO.11	NO.12	NO.13	NO.14	NO.15	NO.16
ABA	40	40	53	40	40	40	40	40
SOL3080	180	180	217	180	180	180	230	180
PPG400	75	75		75	75	75		75
DMSO	155	105	130	55	155	105	130	55
AMD810	50	100	100	150				
2EHX					50	100	100	150
合計	500	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	蛍光	蛍光	蛍光	澄明	白濁	蛍光	白濁
経過時間	上記乳剤希釈液の沈殿析出状態							
2時間後	-	-	-	-	-	-	-	±
8時間後	-	-	-	-	-	-	-	+
1日後	-	-	-	-	-	±	+	++
4日後	+	+	+	+	+	+	+	++

20

30

【0027】

【表 1 - 3】

右：製剤番号 下：成分重量	NO.17	NO.18	NO.19	NO.20	NO.21	NO.22	NO.23
ABA	40	40	40	40	40	40	40
SOL3080	130	130	180	230	230	280	330
PPG400	200	150	150	100	50	50	
DMSO	130	180	130	130	180	130	130
合計	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明
経過時間	上記乳剤希釈液の沈殿析出状態						
2時間後	-	-	-	-	-	-	-
8時間後	-	-	-	-	-	-	-
1日後	+	±	±	±	-	±	-
4日後	+	±	+	±	-	±	-

40

【0028】

以上の製剤例 1、表 1 - 2 に示すごとく、AMD810、2EHX など、極性溶剤であ

50

っても難水溶性溶剤の場合はミセルの安定性が低下することは明らかであった。また、表1-2、NO.16とNO.14の比較に示すごとく、難水溶性溶剤を減少することによって乳化の安定性を向上することができる。

【0029】

(製剤例2) アバメクチン乳剤の調製 その2

アバメクチン40mgに下記界面活性剤、および溶剤を加えて500mgの乳剤を調製した。この50 μ lを水道水(硬度約70)50mlに希釈して、製剤例1と同様に、希釈時の状態、および22に静置して経時的な沈殿の析出状態を4日間観察した。その成分組成と沈殿の析出状態を表2に示す。

【0030】

【表2】

右：製剤番号 下：成分重量	NO.24	NO.25	NO.26	NO.27	NO.28	NO.29	NO.30	NO.31
ABA	40	40	40	40	40	40	40	40
NCP120	140	140	140					
S465				140				
NA41B	190			190				
NEP70G		190						
NFS700G			190					
SOL3080							180	
SOL3880					80	180		
DMSO	130	130	130	130	130	130	130	330
EL								130
SF02					250	150	150	
合計	500	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	澄明	澄明	白濁	白濁	蛍光	蛍光	白濁
経過時間	上記乳剤希釈液の沈殿析出状態							
2時間後	-	-	-	-	++	-	-	-
8時間後	-	-	-	-	++	-	-	±
1日後	-	-	-	±	++	±	-	+
4日後	±	-	±	+	++	+	-	+

【0031】

以上の表2、NO.28、NO.29に示すごとく、難水溶性の芳香族系炭化水素系溶剤(SF02)を用いる場合は、表1-2、NO.16、NO.14の比較と同様にミセル安定には使用量を減少する必要があった。また、非イオン系界面活性剤、陰イオン系界面活性剤を併用した場合、界面活性剤の違いはミセルの安定に大きな差を認めなかった。

【0032】

(製剤例3) 水溶性溶剤、および有効成分の変動と乳化性

アバメクチン、イベルメクチン(和光純薬株式会社商品 純度95%)、ドラメクチン(関東化学株式会社商品 純度96%)、モキシデクチン(関東化学株式会社商品 純度96.5%)の7.5%乳剤を下記の界面活性剤、および溶剤を用いて調製した。また、動物の皮膚滴下駆虫薬セラメクチン12%(レポリューション12% ファイザー株式会社製品)と下記の溶剤、および界面活性剤を用いてセラメクチンの5.0%乳剤を調製した。セラメクチン乳剤は水道水(硬度約70)で667倍に希釈し、その他の調製乳剤は1000倍に希釈した。製剤例1と同様に、希釈時の状態、および22に静置して経時的な沈殿の析出状態を4日間観察した。これらの成分組成と沈殿の析出状態を表3に示す。

【0033】

【表 3】

右：製剤番号 下：成分重量	NO.32	NO.33	NO.34	NO.35	NO.36	NO.37	NO.38	NO.39
ABA	40	40	40	40				
IVE					40			
DOR						40		
MOX							40	
SEL12%								210
SOL3080	180	180	180	230	230	230	230	230
DMSO	130	130	130		230	230	230	60
EL	150							
DEGBE		150						
DPG			150					
NMP				230				
合計	500	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明
経過時間	上記乳剤希釈液の沈殿析出状態							
2時間後	—	—	—	—	—	—	—	—
8時間後	—	—	—	—	—	—	—	—
1日後	—	—	—	—	—	—	—	—
4日後	—	—	±	—	±	—	—	—

10

20

【0034】

以上、表3、NO.32からNO.35に示すごとく、水溶性の高い溶剤を用いることによってミセルの安定性は確保された。また、その他のアバメクチンに類似する16員環マクロライド系化合物においても安定な乳剤の調製が可能であった。なお、動物の皮膚滴下駆虫薬レボリューション12%の1600倍希釈液(75ppm)は希釈時に結晶の析出が認められた。

【0035】

(製剤例4)高濃度乳剤の調製

アバメクチン、ドラメクチン、エプリノメクチン(関東化学株式会社商品 純度94%)、イベルメクチン、モキシデクチンの15%乳剤を下記のジメチルスルホキシド、および界面活性剤を用いて調製した。調製した乳剤を水道水(硬度約70)で1000倍に希釈し、製剤例1と同様に、希釈時の状態、および22に静置して経時的な沈殿の析出状態を4日間観察した。これらの成分組成と沈殿の析出状態を表4に示す。

30

【0036】

【表4】

右：製剤番号 下：成分重量	NO.40	NO.41	NO.42	NO.43	NO.44	NO.45	No.46	No.47
ABA	80	80	80	80				
DOR					80			
EPR						80		
IVE							80	
MOX								80
DMSO	210	210	210	210	210	210	210	210
SOL3080	210				210	210	210	210
SOLT15		60	94	130				
SOLT15S		150	116	80				
合計	500	500	500	500	500	500	500	500
希釈時状態	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明	澄明
経過時間	上記希釈液の沈殿析出状態							
2時間後	—	—	—	—	—	—	—	—
8時間後	—	—	—	—	—	—	—	—
1日後	—	—	—	—	—	—	—	—
4日後	±	—	±	±	±	±	±	±

10

【0037】

以上のように、高濃度乳剤においても安定な調製が可能であった。

20

【0038】

(製剤例5) アバメクチン粒剤の調製

100ml三角フラスコに粒度の異なる珪石もしくはアタパルジャイトを入れ、マグネチックスターラーで攪拌しながら、製剤例1、NO.3、NO.11、および製剤例2、NO.28によるアバメクチン乳剤の所定量を滴下した。珪石を担体とした物は、更に固着防止に多孔質珪酸を添加して粒剤を調製した。その成分組成を表5に示す。

使用した担体、および粒度は以下の通りである。

珪石5号 150μmから850μm(三河珪石株式会社製品)

珪石V7号 106μmから300μm(三河珪石株式会社製品)

アタパルジャイト24/48 300μmから710μm

(OIL-DRY Corporation of America社製品)

多孔質珪酸(カープレックス#80 DSLジャパン株式会社製品)

30

【0039】

【表5】

右：製剤記号 下：成分重量	SI710	SI515	SI715	AT015	SI715B	SI720
NO.3乳剤	140	210	210	210		
NO.11乳剤						210
NO.28乳剤					210	
珪石5号		9640				
珪石V7号	9760		9640		9640	9640
アタパルジャイト				9790		
多孔質珪酸	100	150	150		150	150
合計	10000	10000	10000	10000	10000	10000
有効成分濃度	0.10%	0.15%	0.15%	0.15%	0.15%	0.20%

40

上記表中の数値は、有効成分濃度を除き、全てmgである。

【0040】

(製剤例6) アバメクチン粒剤、ドラメクチン粒剤の調製

100ml三角フラスコにアタパルジャイト、もしくは粒度の異なる珪石を入れ、マグネ

50

チックスターラーで攪拌しながら、製剤例 4、NO. 40 によるアバメクチン 15% 乳剤、および NO. 44 によるドラメクチン 15% 乳剤を製剤例 5 と同様に 0.15% 粒剤を調製した。その成分組成を表 6 に示す。

【0041】

【表 6】

右：製剤記号 下：成分重量	AT015A	SI515A	SI715A	AT015D	SI515D	SI715D
NO.40 乳剤	100	100	100			
NO.44 乳剤				100	100	100
珪石 5 号		9830			9830	
珪石 V 7 号			9830			9830
アタパールジャイト	9900			9900		
多孔質珪酸		70	70		70	70
合計	10000	10000	10000	10000	10000	10000

上記表中の数値は、全て mg である。

【0042】

(線虫防除試験例 1) マクロライド系化合物のネコブセンチュウ防除能

製剤例 1、NO. 3 によるアバメクチン 7.5% 乳剤、および製剤例 3 によるドラメクチン 7.5% 乳剤、イベルメクチン 7.5% 乳剤、モキシデクチン 7.5% 乳剤、およびセラメクチン 5.0% 乳剤、市販の 16 員環マクロライド系殺虫剤である、エマメクチン安息香酸塩 1% 乳剤 (アフーム乳剤 シンジエンタジャパン株式会社製品)、ミルベメクチン 1% 乳剤 (コロマイト乳剤 三井化学アグロ株式会社製品)、レピメクチン 1% 乳剤 (アニキ乳剤 三井化学アグロ株式会社製品)、およびネマデクチン 3.6% 液剤 (メカトップ液剤 株式会社理研グリーン製品) をそれぞれ水道水 (硬度約 70) で有効成分濃度 10 ppm に希釈調製した。サツマイモネコブセンチュウの増殖した洪積世火山灰土壌 (4 反復平均初期サツマイモネコブセンチュウ密度 235 頭 / 20 g 土壌) 1 L をポリエチレン袋に入れ、各薬剤の 10 ppm 液 30 ml を噴霧しながら混和した。薬剤を混和した土壌を表面積 162 cm² のポットに充填した。比較対照薬剤として市販の有機リン系殺線虫剤ホスチアゼート 1.5% 粒剤 (石原ネマトリンエース粒剤 石原産業株式会社製品) 200 mg の土壌 1 L 混和処理区、および無処理区を設定した。薬剤処理後、ミニトマト (品種レジナ 本葉 3 葉苗 タキイ種苗株式会社商品) を 3 株定植した。試験は 2 反復で行い、温室で栽培管理を行った。6 週間後に地上部重量、ネコブ寄生度を調査した。その結果の平均値を表 7-1、表 7-2 に示す。

以下の試験におけるネコブ寄生度の評価基準は下記の通りである。

調査時には下記寄生度に中間位 0.5 を加えた。

寄生度 0 全くネコブを認めない。

寄生度 1 根の 25% 以下にネコブの形成が認められる。

寄生度 2 根の 25% から 50% 以下にネコブの形成が認められる。

寄生度 3 根の 50% から 75% 以下にネコブの形成が認められる。

寄生度 4 根の 75% を超えてネコブの形成が認められる。

【0043】

【表 7-1】

有効成分名	ABA	DOR	EMA	IVE	LEP	MIL
噴霧液濃度 ppm	10	10	10	10	10	10
土壌中濃度 ppm	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3	0.3
地上部重 g/株	3.7	3.8	3.3	3.7	3.1	2.5
ネコブ寄生度	0.75	0.58	3.92	0.83	4.00	4.00

10

20

30

40

50

【 0 0 4 4 】

【表 7 - 2】

有効成分名	MOX	NEM	SEL	対照薬剤	無処理
噴霧液濃度 ppm	10	10	10		
土壌中濃度 ppm	0.3	0.3	0.3	3.0	
地上部重 g/株	4.1	3.0	2.6	3.6	2.1
ネコブ寄生度	1.33	4.00	4.00	0.00	4.00

【 0 0 4 5 】

10

以上、低温下に推移してトマトの生育は不良であったが、乳剤を希釈して土壌に噴霧後混和した薬剤処理区の地上部重量は全ての薬剤処理区で無処理区に勝った。一方、有効成分土壌中濃度 0.3 ppm において、明らかな線虫防除効果が認められた化合物は、アベルメクチン系化合物のアバメクチン、ドラメクチン、およびイベルメクチンであった。同じアベルメクチン系化合物の中で、糖鎖が短いセラメクチン、およびエマメクチンは明らかに効果が劣った。エマメクチンは糖鎖のヒドロキシ基をメチルアミノ基に置換して安息香酸塩とした結果、土壌との親和性が向上して拡散が妨げられたものと推定される。その他、糖鎖を持たないミルベマイシン系化合物の中ではモキシデクチンに効果が認められた。

【 0 0 4 6 】

20

(線虫防除試験例 2) アバメクチン、およびモキシデクチンのネコブセンチュウ防除能
製剤例 1、NO. 3 によるアバメクチン 7.5% 乳剤、および製剤例 3、NO. 3 によるモキシデクチン 7.5% 乳剤を水道水(硬度約 70)で有効成分濃度 5 ppm、10 ppm、および 20 ppm に希釈調製した。サツマイモネコブセンチュウの増殖した洪積世火山灰土壌(初期サツマイモネコブセンチュウ密度 4 反復平均 260 頭/20 g 土壌) 1 L をポリエチレン袋に入れて各 30 ml を噴霧しながら混和した。薬剤を混和した土壌を表面積 162 cm² のポットに充填した。比較対照薬剤として市販の有機リン系殺線虫剤ホスチアゼート 1.5% 粒剤 200 mg の土壌 1 L 混和処理区、および無処理区を設定した。薬剤処理後、ミニトマト(品種レジナ 本葉 4 葉苗)を 4 株定植した。試験は 2 反復で行い、温室で栽培管理を行った。8 週間後に地上部重量、ネコブ寄生度を調査した。

30

その結果の平均値を表 8 に示す。

【 0 0 4 7 】

【表 8】

有効成分名	ABA	ABA	ABA	MOX	MOX	MOX	対照薬剤	無処理
噴霧液濃度 ppm	5	10	20	5	10	20		
土壌中濃度 ppm	0.15	0.3	0.6	0.15	0.3	0.6	3.0	
地上部重 g/株	55	49	45	44	54	42	43	18
ネコブ寄生度	2.38	1.17	1.00	2.81	1.75	1.38	1.25	4.00

40

【 0 0 4 8 】

線虫防除能力でアバメクチンはモキシデクチンに比べやや効果が優れた。いずれの化合物も土壌中濃度 0.15 ppm ではネコブ寄生度が 2 を上回り、線虫密度が高い場合や、有機物含有量の高い土壌においては効果が不十分と判断された。

【 0 0 4 9 】

(線虫防除試験例 3) アバメクチン粒剤の違い、および薬剤処理方法の違いによるネコブセンチュウ防除能

サツマイモネコブセンチュウの増殖した洪積世火山灰土壌(初期サツマイモネコブセンチュウ密度 4 反復平均 83 頭/20 g 土壌) 1 L を表面積 162 cm² のポットに詰め、製剤例 5、表 5 に示す各粒剤の所定量を土壌混和した。また、製剤例 1、NO. 3 によ

50

るアバメクチン7.5%乳剤を水道水(硬度約70)で希釈した100ppm液3ml、および10ppm液30mlを土壌に噴霧しながら混和した。比較対照薬剤としてホスチアゼート1.5%粒剤200mgの土壌1L混和处理区、および無処理区を設定した。薬剤処理後、ミニトマト(品種レジナ 本葉4葉苗)を3株定植した。またミニトマト定植後にアバメクチン10ppm液30mlの土壌表面灌注処理区設けた。試験は2反復で行い、温室で栽培管理を行った。8週間後に地上部重量、ネコブ寄生度を調査した。その結果の平均値を表9-1、表9-2に示す。

【0050】

【表9-1】

製剤記号	SI710	SI710	SI515	SI715	AT015	SI715B	SI720
処理薬量 mg/L 土壌	200	400	200	200	200	200	200
土壌中濃度 ppm	0.2	0.4	0.3	0.3	0.3	0.3	0.4
土壌処理方法	混和	混和	混和	混和	混和	混和	混和
地上部重 g/株	32	33	31	29	33	30	31
ネコブ寄生度	1.08	0.83	1.08	0.75	1.42	1.08	0.92

【0051】

【表9-2】

製剤番号 処理液成分濃度	NO.3 100ppm	NO.3 10ppm	NO.3 10ppm	対照薬剤	無処理
処理薬量 mg/L 土壌	3000	30000	30000	200	
土壌中濃度 ppm	0.3	0.3	0.3	3.0	
土壌処理方法	混和	混和	表面灌注	混和	
地上部重 g/株	28	30	29	30	27
ネコブ寄生度	0.75	1.00	2.08	0.25	3.17

【0052】

(線虫防除試験例4)有効成分、担体、および粒径と線虫防除能の比較

サツマイモネコブセンチュウの増殖した洪積世火山灰土壌(初期サツマイモネコブセンチュウ密度 4反復平均48頭/20g土壌)1Lを表面積162cm²のポットに詰め、製剤例6、表6に示す各粒剤の所定量を土壌混和した。比較対照薬剤としてホスチアゼート1.5%粒剤200mgの土壌1L混和处理区、および無処理区を設定した。薬剤処理後、ミニトマト(品種レジナ 本葉4葉苗)を3本定植した。試験は2反復で行い、温室で栽培管理を行った。8週間後に地上部重量、ネコブ寄生度を調査した。その結果の平均値を表10-1、表10-2に示す。

【0053】

【表10-1】

製剤記号	AT015A	SI515A	SI715A	対照薬剤
処理薬量 mg/L 土壌	200	200	200	200
土壌中濃度 ppm	0.3	0.3	0.3	3.0
土壌処理方法	混和	混和	混和	混和
地上部重 g/株	54	55	66	50
ネコブ寄生度	1.50	0.83	0.75	0.08

【0054】

【表 10 - 2】

製剤記号	AT015D	SI515D	SI715D	無処理
処理薬量 mg/L 土壌	200	200	200	
土壌中濃度 ppm	0.3	0.3	0.3	
土壌処理方法	混和	混和	混和	
地上部重 g/株	54	52	59	58
ネコブ寄生度	1.75	1.08	0.67	2.92

10

【0055】

以上、線虫防除試験例 1、線虫防除試験例 2、線虫防除試験例 3、および線虫防除試験例 4 から、有機物含有量が高い洪積世火山灰土壌においても、本発明による水溶性溶媒を主体に調製した 16 員環マクロライド化合物の乳剤を水で希釈して土壌に散布しながら混和する、もしくは水溶性溶媒を主体に調製した乳剤を用いて粒剤を調製し、土壌中有効成分濃度を 0.2 ppm から 0.6 ppm になるように混和すればサツマイモネコブセンチュウを効果的に防除しうることが明らかになった。一方、線虫防除試験例 3 に示すごとく洪積世火山灰土壌においては、本発明による乳剤希釈液の同薬量を土壌表面に 1.85 t / 10 a 相当量の灌注処理を行っても混和处理に比べて線虫防除効果は低く、有効成分の下方移行は不十分と判断された。また、線虫防除試験例 3、表 9 - 1 に示すごとく希釈時

20

に澄明となるマイクロエマルジョン処方と白濁する処方ではマイクロエマルジョン処方がやや優った。また、粒径の小さな調製品は粒径の大きな調製品に比較して効果が優れた。また、線虫防除試験例 4 に示すごとく、吸油能が高い一方でイオン交換能が低いとされるアタパルジャイトを担体とする調製品は、珪石を担体とした調製品に劣り、有効成分の溶出が不十分であると推定された。

フロントページの続き

(56)参考文献 中国特許出願公開第101642131(CN, A)

特開平07-173017(JP, A)

特開2011-246455(JP, A)

特開2011-157347(JP, A)

特開平11-043408(JP, A)

国際公開第02/049437(WO, A1)

中国特許出願公開第1325626(CN, A)

農薬製剤ガイド, 1997年10月30日, 第14-17頁

Fuliang Chen, et al., Studies on cloud point of agrochemical microemulsions, Colloids and Surfaces A: Physicochemical and Engineering Aspects, 2000年12月15日, vol.175 no.1-2, p.257-262

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 25/00-65/48

A01P 1/00-23/00

CAPLUS/REGISTRY/MEDLINE/BIOSIS/WPIDS(STN)

JSTPLUS/JMEDPLUS/JST7580(JDreamIII)