

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5502854号
(P5502854)

(45) 発行日 平成26年5月28日 (2014.5.28)

(24) 登録日 平成26年3月20日 (2014.3.20)

(51) Int. Cl.		F I	
AO1N 43/56	(2006.01)	AO1N 43/56	C
AO1P 3/00	(2006.01)	AO1P 3/00	
AO1N 43/653	(2006.01)	AO1N 43/653	G
		AO1N 43/653	C

請求項の数 24 (全 15 頁)

(21) 出願番号	特願2011-507889 (P2011-507889)	(73) 特許権者	508020155
(86) (22) 出願日	平成21年5月5日 (2009.5.5)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
(65) 公表番号	特表2011-519890 (P2011-519890A)		ア
(43) 公表日	平成23年7月14日 (2011.7.14)		BASF SE
(86) 国際出願番号	PCT/EP2009/055407		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(87) 国際公開番号	W02009/135834		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(87) 国際公開日	平成21年11月12日 (2009.11.12)	(74) 代理人	100091096
審査請求日	平成24年5月2日 (2012.5.2)		弁理士 平木 祐輔
(31) 優先権主張番号	08155881.9	(74) 代理人	100118773
(32) 優先日	平成20年5月8日 (2008.5.8)		弁理士 藤田 節
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)	(74) 代理人	100122389
			弁理士 新井 栄一

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 菌類感染から大豆を保護する方法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

大豆植物を有害菌類による感染から保護する方法であって、大豆植物、その種子または土壌を、殺菌に有効な量の

- a) ピクサフェン(1) および
- b) メトコナゾール

を含む相乗作用的に活性な組合せで処理する、前記方法。

【請求項 2】

アルタナリア(Alternaria) 属の種が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 3】

セルコスボラ・キクチイ(Cercospora kikuchi) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 4】

セルコスボラ・ソジナ(Cercospora sojina) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 5】

コレトトリクム・トルンカタム(Colletotrichum truncatum) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 6】

コリネスボラ・カシイコラ(Corynespora cassiicola) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 7】

ミクロスファエラ・ディフサ (Microsphaera diffusa) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 8】

ファコブソラ・メイボミエ (Phakopsora meibomiae) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 9】

ファコブソラ・パキリジ (Phakopsora pachyrhizi) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 10】

セプトリア・グリシンス (Septoria glycines) が防除される請求項1記載の方法。

【請求項 11】

- a) ビクサフェン (I) および
b) メトコナゾール

を含む製剤の水性調製物が、植物の地上部分に施用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 12】

種子処理または土壌処理によって有害菌類が防除される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 13】

- a) ビクサフェン (I)、
b) メトコナゾール、および
c) 少なくとも1種のさらなる市販の殺菌剤

の組合せが使用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 14】

- a) ビクサフェン (I)、
b) メトコナゾール、および
c) 大豆作物が耐性をもつ、少なくとも1種の市販の除草剤

の組合せが使用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 15】

- a) ビクサフェン (I)、
b) メトコナゾール、および
c) 少なくとも1種の市販の殺虫剤

の組合せが使用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 16】

- a) ビクサフェン (I)、
b) メトコナゾール、および
c) 以下の群より選択される少なくとも1種の活性化化合物(III)：

・ グリフォセート(glyphosate)、スルフォセート(sulphosate)、グルフォシネート(gluphosinate)、テフルスリン(tefluthrin)、テルブフォス(terbufos)、クロルピリフォス(chlorpyrifos)、クロロエトキシフォス(chloroethoxyfos)、テブピリムフォス(tebupirimfos)、フェノキシカルブ(phenoxy carb)、ジオフェノラン(diofenolan)、ピメトロジン(pymetrozine)、イマゼタピル(imazethapyr)、イマザモックス(imazamox)、イマザピル(imazapyr)、イマザピック(imazapic)、イマザキン(imazaquin) またはジメテナミド-P(dimethenamid-P)；

・ フィプロニル(fipronil)、イミダクロプリド(imidacloprid)、アセタミプリド(acetamiprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ジノテフラン(dinotefuran)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、クロチアニジン(clothianidin)、ジフルベンズロン(diflubenuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、テフルベンズロン(teflubenuron)、アルファ-サイパーメトリン(alpha-cypermethrin) およびメタフルミゾン(metaflumizone)

10

20

30

40

50

の組合せが使用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 17】

活性成分が、同時に、すなわち一緒にもしくは別々に、または連続して施用される請求項13~16のいずれか1項記載の方法。

【請求項 18】

組合せが、5 g/ha ~ 2500 g/haの量で施用される請求項13~16のいずれか1項記載の方法。

【請求項 19】

活性成分として、

a) ビクサフェン(Ⅰ)、

b) メトコナゾール、および

c) グリフォセート(glyphosate)、スルフォセート(sulphosate)、グルフォシネート(glyphosinate)、テフルスリン(tefluthrin)、テルブフォス(terbufos)、クロルピリフォス(chlorpyrifos)、クロロエトキシフォス(chloroethoxyfos)、テブピリムフォス(tebupirifos)、フェノキシカルブ(phenoxy carb)、ジオフェノラン(diofenolan)、ピメトロジン(pyrimetozine)、イマゼタピル(imazethapyr)、イマザモックス(imazamox)、イマザピル(imazapyr)、イマザピック(imazapic)、イマザキン(imazaquin) またはジメテナミド-P(dimethenamid-P)

を、成分a) : 成分b)が100 : 1 ~ 1 : 100の重量比で含む殺菌組成物。

【請求項 20】

液体もしくは固体担体および請求項19記載の組成物を含む殺菌剤。

【請求項 21】

a) ビクサフェン(Ⅰ)、および

b) メトコナゾール

を含む組成物が、種子100 kg当たり1 ~ 2000 gの量で施用される請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の方法。

【請求項 22】

a) ビクサフェン(Ⅰ)、

b) メトコナゾール、および

c) 少なくとも1種の市販のさらなる活性化化合物(III)

を含む組成物が、種子100 kg当たり合計で1 ~ 2000 gの量で施用される請求項16記載の方法。

【請求項 23】

請求項19記載の殺菌組成物または請求項20記載の殺菌剤を、種子100 kg当たり1 ~ 2000 gの量で含む種子。

【請求項 24】

大豆植物を有害菌類による感染から保護するのに適当な組成物を製造するための、請求項 1 ~ 10のいずれか1項記載の

a) ビクサフェン(Ⅰ)、および

b) メトコナゾール、および所望なら

c) 請求項14 ~ 16のいずれか1項記載のさらなる市販の活性化化合物(III)

を含む組成物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、大豆植物を特定の有害菌類による感染から保護する方法であって、大豆植物、その種子または土壌を、殺菌に有効な量の

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(II)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

10

20

30

40

50

を含む相乗作用的に活性な組合せで処理する、前記方法に関する。

【背景技術】

【0002】

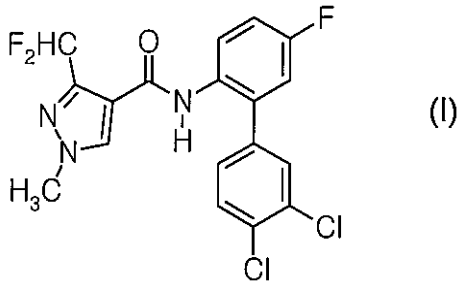
近年、南アフリカにおいて大豆作物の菌類感染が増加しており、著しい収穫損失および生産損失という結果をもたらしている。上記した化合物は殺菌活性であることが知られているが、大豆におけるそれらの殺菌能はまだ、全ての点で完全に満足のいくものとはいえない。

【0003】

ピクサフェン (IUPAC名: N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチルピラゾール-4-カルボキシアミド)

10

【化1】



【0004】

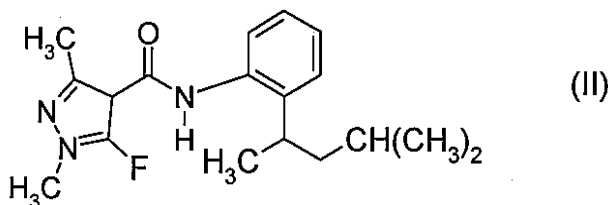
20

は、WO 03/070705から公知であり、そこに記載された方法で製造することができる。

【0005】

N-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド (一般名ペンフルフェン (Penflufen))

【化2】



30

【0006】

は、WO 03/010149から公知であり、そこに記載された方法で製造することができる。

【0007】

上記化合物および構造的に関連のある化合物と、異なる種類の構造の種々の他の化合物との殺菌組成物は、それぞれWO 2005/034628およびWO 2005/041653から公知である。

【0008】

しかしながら、化合物(I)または(II)および他の活性成分からなる公知の組成物の、穀物植物における菌類病原体に対する殺菌能は、全ての点で完全に満足のいくものとはいえない。

40

【先行技術文献】

【特許文献】

【0009】

【特許文献1】WO 03/070705

【特許文献2】WO 03/010149

【特許文献3】WO 2005/034628

【特許文献4】WO 2005/041653

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0010】

50

ここで、

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

を含む組合せが、大豆作物において有害菌類に対して優れた活性を有することがわかった。

【0011】

化合物(Ⅰ)および(Ⅱ)は、種々の結晶変態(crystal modification)で存在することができ、それらは生物活性において異なり得る。その使用はまた、本発明の主題の一部を形成する。

10

【0012】

エポキシコナゾールおよびメトコナゾール、それらの製造ならびに有害菌類に対するそれらの作用は一般に、当業者に公知である。どちらの化合物も市販されていて入手可能である(例えば、www.alanwood.net/pesticides/index_cn_frame.html参照)。

【発明を実施するための形態】

【0013】

本発明の1つの態様においては、ビクサフェン(Ⅰ)およびエポキシコナゾールを含む組合せが好ましい。

【0014】

本発明の別の態様においては、ビクサフェン(Ⅰ)およびメトコナゾールを含む組合せ

20

が好ましい。

【0015】

本発明のなお別の態様においては、N-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ) およびエポキシコナゾールを含む組合せが好ましい。

【0016】

本発明のなお別の態様においては、N-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ) およびメトコナゾールを含む組合せが好ましい。

【0017】

30

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

を含む組合せは、大豆作物において、以下の有害菌類：

- ・ アルタナリア(Alternaria)属の種,
- ・ セルコスボラ・キクチイ(Cercospora kikuchi),
- ・ セルコスボラ・ソジナ(Cercospora sojina),
- ・ コレトトリクム・トルンカタム(Colletotrichum truncatum),
- ・ コリネスボラ・カシイコラ(Corynespora cassiicola),
- ・ ミクロスファエラ・ディフサ(Microsphaera diffusa),
- ・ ファコプソラ・メイボミエ(Phakopsora meibomiae),
- ・ ファコプソラ・パキリジ(Phakopsora pachyrhizi)および/または
- ・ セプトリア・グリシンス(Septoria glycines)

40

を防除するために特に適当である。

【0018】

本発明の1つの態様においては、アルタナリア(Alternaria)属の種の防除が特に好ましい。

【0019】

本発明の別の態様においては、セルコスボラ・キクチイ(Cercospora kikuchi)の防除が特に好ましい。

50

【 0 0 2 0 】

本発明のなお別の態様においては、セルコスボラ・ソジナ(*Cercospora soja*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 1 】

本発明のなお別の態様においては、コレトトリクム・トルンカタム(*Colletotrichum truncatum*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 2 】

本発明のなお別の態様においては、コリネスボラ・カシイコラ(*Corynespora cassicola*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 3 】

本発明のなお別の態様においては、ミクロスファエラ・ディフサ(*Microsphaera diffusa*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 4 】

本発明のなお別の態様においては、ファコプソラ・メイボミエ(*Phakopsora meibomia*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 5 】

本発明のなお別の態様においては、ファコプソラ・パキリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 6 】

本発明のなお別の態様においては、セプトリア・グリシンス(*Septoria glycines*)の防除が特に好ましい。

【 0 0 2 7 】

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

の組合せを用いて処理される大豆植物または種子は、野生型、育種によって得られる植物または種子および形質転換植物ならびにそれらの種子であることができる。

【 0 0 2 8 】

ビクサフェンおよびエポキシコナゾールまたはメトコナゾールは、同時に、すなわち一緒にもしくは別々に、または連続して施用することができ、別々の施用の場合に、順序は一般に、防除処置の結果にいかなる影響をも及ぼさない。

【 0 0 2 9 】

有害菌類は、

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

を含む組合せを、種子を処理することにより、植物の播種前もしくは後に、または植物の出芽前もしくは後に植物もしくは土壤に噴霧するかまたは振りかけることにより施用することによって、防除される。

【 0 0 3 0 】

大豆作物における菌類による疾病は、

a) ビクサフェン(Ⅰ)またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(Ⅱ)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

を含む製剤、またはその単一成分を含む製剤の水性調製物を、植物の地上部分に、特に葉に施用することによって、または高い全体浸透性効果のために予防薬として、種子または土壤を処理することによって、有利に防除される。

【 0 0 3 1 】

化合物(Ⅰ)およびエポキシコナゾールもしくはメトコナゾール、または化合物(Ⅱ)およびエポキシコナゾールもしくはメトコナゾールはそれぞれ、通常100:1~1:100、好まし

10

20

30

40

50

くは20 : 1 ~ 1 : 20、特に10 : 1 ~ 1 : 10の重量比で施用される。

【 0 0 3 2 】

一般的に、

a) ビクサフェン (I) またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(II)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

の組合せが使用されるが、有害菌類または他の有害生物、例えば昆虫、クモ類もしくは線虫類に対して活性なさらなる化合物、あるいは除草剤化合物もしくは成長調節活性化合物または肥料を添加することができる。

【 0 0 3 3 】

したがって、本発明はまた、大豆作物において有害菌類を防除するための殺菌混合物であって、混合物が、活性成分として、

a) ビクサフェン (I) またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(II)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール、および

c) 少なくとも1種の先に示したさらなる活性化合物(III)

の組合せを含む殺菌混合物に関する。

【 0 0 3 4 】

本発明の方法においては、殺菌組成物は、他の活性化合物(III)、例えば除草剤、殺虫剤、成長調節剤、さらなる殺菌剤と一緒に、または肥料と一緒に有利に施用することができる。この性質を有する適当なさらなる混合のパートナーは特に：

・ グリフォセート(glyphosate)、スルフォセート(sulphosate)、グルフォシネート(gluphosinate)、テフルスリン(tefluthrin)、テルブフォス(terbufos)、クロルピリフォス(chlorpyrifos)、クロロエトキシフォス(chloroethoxyfos)、テブピリムフォス(tebupirimfos)、フェノキシカルブ(phenoxy carb)、ジオフェノラン(diofenolan)、ピメトロジン(pymetrozine)、イマゼタピル(imazethapyr)、イマザモックス(imazamox)、イマザピル(imazapyr)、イマザピック(imazapic)、イマザキン(imazaquin) またはジメテナミド-P(dimethenamid-P)、特にグリフォセート(glyphosate)、スルフォセート(sulphosate)、グルフォシネート(gluphosinate)、またはジメテナミド-P(dimethenamid-P)；

・ フィプロニル(fipronil)、イミダクロプリド(imidacloprid)、アセタミプリド(acetamiprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ジノテフラン(dinotefuran)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、クロチアニジン(clothianidin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、アルファ-サイパーメトリン(alpha-cypermethrin) およびメタフルミゾン(metaflumizone)、特にフィプロニル(fipronil)、イミダクロプリド(imidacloprid)、アセタミプリド(acetamiprid)、カルボフラン(carbofuran)、チアメトキサム(thiamethoxam)、クロチアニジン(clothianidin)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、アルファ-サイパーメトリン(alpha-cypermethrin) およびメタフルミゾン(metaflumizone)

である。

【 0 0 3 5 】

上記したそれらの他の活性化合物(III)は通常、化合物(I)または(II)の量に基づき、100 : 1 ~ 1 : 100、好ましくは20 : 1 ~ 1 : 20、特に10 : 1 ~ 1 : 10の重量比で使用される。

【 0 0 3 6 】

最も好ましくは、さらなる活性化合物(III)は、(I)または(II)およびエポキシコナゾールまたはメトコナゾールと一緒に、相乗作用的に有効な量で施用される。

【 0 0 3 7 】

上記した

a) ビクサフェン (I) またはN-[2-(1,3-ジメチルブチル)-フェニル]-1,3-ジメチル-5-

10

20

30

40

50

フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキシアミド(II)および

b) エポキシコナゾールまたはメトコナゾール

と除草剤との混合物は、これらの除草剤、特にグリフォセート(glyphosate)および上記したイミダゾリノン化合物に対する植物の感受性が低下している作物において特に使用される。

【0038】

a)化合物(I)または(II)およびb)エポキシコナゾールまたはメトコナゾールを含む組合せを大豆作物に施用すると、収穫量が著しく増加する。かくして、化合物(I)およびエポキシコナゾールもしくはメトコナゾール、または化合物(II)およびエポキシコナゾールもしくはメトコナゾールを含む組合せはそれぞれまた、収穫量を増加させるために使用することができ、大豆作物における有害菌類に対する優れた作用と組み合わせた収穫量の増加によって、本発明の方法は、特に農家のために役立つ。

10

【0039】

殺菌、殺虫および/または除草に活性な化合物(III)との、a)化合物(I)または(II)およびb)エポキシコナゾールまたはメトコナゾールを含む組合せは、菌類または菌類の攻撃に対して保護すべき植物、資材または種子を、あるいは土壌を、殺菌に有効な量の活性化化合物で処理することによって施用される。施用は、菌類が資材または植物に感染する前および後の両方であることができる。

【0040】

化合物(I)または(II)がそれだけで使用される場合、本発明の方法における施用割合は、望まれる効果のタイプに依存して、1ヘクタール当たり0.01~1.5 kgの活性化化合物である。

20

【0041】

種子の処理においては、必要とされる活性化化合物(I)または(II)の量は、種子100 kg当たり一般に1~1500 g、好ましくは10~500 gである。

【0042】

所望の効果に依存して、本発明の混合物の施用割合は、10 g/ha~2500 g/ha、好ましくは50~2000 g/ha、特に100~1500 g/haである。

【0043】

化合物(I)または(II)についての施用割合は、一般に1~1000 g/ha、好ましくは10~750 g/ha、特に20~500 g/haである。

30

【0044】

エポキシコナゾール、メトコナゾールおよび、所望なら、さらなる殺菌、殺虫および/または除草に活性な化合物(III)についての施用割合は、一般に1~1500 g/ha、好ましくは10~1250 g/ha、特に20~1000 g/haである。

【0045】

種子の処理においては、本発明の組合せの施用割合は、一般に1~2000 g/種子100 kg、好ましくは1~1500 g/種子100 kg、特に5~1000 g/種子100 kgである。

【0046】

本発明の方法において使用するために、化合物は、慣例の製剤、例えば溶液剤、エマルジョン剤、懸濁剤、粉剤、粉末、ペースト剤および顆粒剤へと変えることができる。使用形態は、特定の意図される目的に依存するが、各場合において、本発明に係る化合物の微細かつ一様な分布を保証すべきである。

40

【0047】

製剤は、例えば、所望なら乳化剤、界面活性剤、分散剤、安定剤、消泡剤および不凍剤を使用して、溶媒および/または担体を用いて活性化化合物を増量することによる、公知の方法で調製される[例えば、US 3,060,084, EP-A 707 445 (液体濃縮物), Browning, "凝集(Agglomeration)", Chemical Engineering, 1967年12月4日, p. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 第4版, McGraw-Hill, New York, 1963年, p. 8-57, WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701,

50

US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961年, Hance ら., Weed Control Handbook, 第8版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989年 および Mollet, H., Grubermann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (ドイツ), 2001年, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998年 (ISBN 0-7514-0443-8) 参照]。種子を処理するための製剤については、着色顔料(例えばローダミンB)、バインダーおよび/または膨張剤を追加的に考慮することができる。

【0048】

この目的のために適当な溶媒/補助剤は本質的に、以下のものである：

- 水、芳香族溶媒(例えばSolvesso(登録商標)製品、キシレン)、パラフィン(例えば鉱油画分)、アルコール(例えばメタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール)、ケトン(例えばシクロヘキサノン、ガンマ-ブチロラクトン)、ピロリドン(N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン)、アセテート(グリコールジアセテート)、グリコール、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸および脂肪酸エステル。原則として、溶媒混合物もまた使用できる。

10

【0049】

- 担体、例えば粉碎された天然無機物(例えばカオリン、クレイ、タルク、チョーク)および粉碎された合成無機物(例えば微細なケイ酸、ケイ酸塩)；乳化剤、例えば非イオン性およびアニオン性乳化剤(例えばポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホネートおよびアリアルスルホネート)ならびに分散剤、例えばリグノサルファイト(lignosulfite)廃液およびメチルセルロース。

20

【0050】

界面活性剤として使用するのに適当なものは、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸のアルカリ金属、アルカリ土類金属およびアンモニウム塩、アルキルアリアルスルホネート、アルキルサルフェート、アルキルスルホネート、脂肪アルコールサルフェート、脂肪酸および硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテル、さらにはスルホン化ナフタレンおよびナフタレン誘導体のホルムアルデヒドとの縮合物、ナフタレンもしくはナフタレンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドとの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシル化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアリルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、アルコールおよび脂肪アルコールエチレンオキシド縮合物、エトキシル化ひまし油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシル化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、ソルビトールエステル、リグノサルファイト廃液およびメチルセルロースである。

30

【0051】

直接噴霧可能な溶液、エマルジョン、ペーストまたは油分散物の調製のために適当な物質は、中沸点から高沸点の鉱油画分、例えばケロセンもしくはディーゼル油、さらにはコールタール油ならびに、植物もしくは動物由来の油、脂肪族、環状および芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンもしくはそれらの誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、極性の高い溶媒、例えばジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドンおよび水である。

40

【0052】

適当な不凍剤は、例えばグリセロール、エチレングリコールおよびプロピレングリコールである。

【0053】

適当な消泡剤は、例えばステアリン酸ケイ素またはステアリン酸マグネシウムである。

50

【 0 0 5 4 】

適当な膨張剤は、例えばトチャカ (carrageen) (Satiagel (登録商標)) である。

【 0 0 5 5 】

バインダーは、活性化化合物の種子上への付着を改善するのに役立つ。適当なバインダーは、例えばポリエチレンオキシド/ポリプロピレンオキシドコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリ(メタ)アクリレート、ポリブテン、ポリイソブチレン、ポリスチレン、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド、ポリエチレンイミン (Lupasol (登録商標)、Polymin (登録商標))、ポリエーテル、ポリウレタン、酢酸ポリビニル、および上記ポリマーのコポリマーである。

【 0 0 5 6 】

散布および振りかけることができる製品のための材料である粉末は、活性物質を固体担体と共に混合するかまたは一緒に粉砕することによって製造することができる。

【 0 0 5 7 】

顆粒剤、例えばコーティングされた顆粒剤、含侵された顆粒剤および均質な顆粒剤は、活性化化合物を固体担体と結合させることによって製造することができる。固体担体の例は、鉱物土類、例えばシリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、アタクレー (attaclay)、石灰石、生石灰、チョーク、ボール、黄土、クレー、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、粉砕した合成材料、肥料、例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素および、植物由来の製品、例えば穀物粉、樹皮粉、木材粉および堅果殻粉、セルロース粉末ならびに他の固体担体である。

【 0 0 5 8 】

一般に製剤は、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%の活性化化合物を含む。活性化化合物は、(NMRスペクトルに従って)90~100%、好ましくは95~100%の純度で使用される。

【 0 0 5 9 】

種子の処理のためには、製剤は2~10倍に希釈されて、0.01~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性化化合物を含む、即時使用可能な調製物とすることができる。

【 0 0 6 0 】

以下は、製剤の例である：

1. 水で希釈するための製品

A) 水溶性濃縮物 (SL, LS)

10重量部の活性化化合物を、90重量部の水または水溶性溶媒で溶かす。あるいは、湿潤剤または他の補助剤を添加する。水で希釈すると活性化化合物は溶解する。これによって、10重量%の活性化化合物含量を有する製剤を与える。

【 0 0 6 1 】

B) 分散性濃縮物 (DC)

20重量部の活性化化合物を、10重量部の分散剤、例えばポリビニルピロリドンを添加して、70重量部のシクロヘキサノン中に溶かす。水で希釈することで、分散物を与える。活性化化合物含量は20重量%である。

【 0 0 6 2 】

C) 乳化性濃縮物 (EC)

15重量部の活性化化合物を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびひまし油エトキシレート (各場合5重量部) を添加して、75重量部のキシレン中に溶かす。水で希釈することで、エマルジョンを与える。製剤は、15重量%の活性化化合物含量を有する。

【 0 0 6 3 】

D) エマルジョン (EW, EO, ES)

25重量部の活性化化合物を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびひまし油エトキシレート (各場合5重量部) を添加して、35重量部のキシレン中に溶かす。この混合物を、乳化機 (例えばUltraturrax) によって30重量部の水に添加し、均質なエマルジョン

10

20

30

40

50

にする。水で希釈することで、エマルジョンを与える。製剤は、25重量%の活性化合物含量を有する。

【0064】

E) 懸濁物(SC,OD,FS)

攪拌されたボールミル中で、10重量部の分散剤および湿潤剤ならびに70重量部の水もしくは有機溶媒を添加し、20重量部の活性化合物を粉碎して、細かい活性化合物懸濁物を与える。水で希釈することで、活性化合物の安定な懸濁物を与える。製剤中の活性化合物含量は、20重量%である。

【0065】

F) 水分散性顆粒および水溶性顆粒(WG, SG)

50重量部の分散剤および湿潤剤を添加し、50重量部の活性化合物を細かく粉碎して、専門的な機械(例えば押出機、噴霧塔、流動床)によって水分散性または水溶性の顆粒にする。水で希釈することで、活性化合物の安定な分散物または溶液を与える。製剤は、50重量%の活性化合物含量を有する。

【0066】

G) 水分散性粉末および水溶性粉末(WP, SP, SS, WS)

25重量部の分散剤、湿潤剤およびシリカゲルを添加し、75重量部の活性化合物を、ローター-ステーターミル中で粉碎する。水で希釈することで、活性化合物の安定な分散物または溶液を与える。製剤の活性化合物含量は、75重量%である。

【0067】

H) ゲル(GF)

10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤および70重量部の水または有機溶媒を添加し、20重量部の活性化合物をビーズミル中で粉碎して、細かい活性化合物懸濁物を与える。水で希釈することで、活性化合物の安定な懸濁物を与える。製剤は、20重量部の活性化合物含量を有する。

【0068】

2. 希釈せずに施用されるべき製品

J) 散布可能な粉末(DP, DS)

5重量部の活性化合物を細かく粉碎し、95重量部の微細なカオリンとよく混合する。これによって、5重量%の活性化合物含量を有する散布可能な製品を与える。

【0069】

K) 顆粒(GR, FG, GG, MG)

0.5重量部の活性化合物を細かく粉碎し、99.5重量部の担体と結合させる。通常の方法は、押出し機、噴霧乾燥または流動床である。これによって、希釈せずに施用されるべき、0.5重量%の活性化合物含量を有する顆粒を与える。

【0070】

L) ULV溶液(UL)

10重量部の活性化合物を、90重量部の有機溶媒、例えばキシレンに溶かす。これによって、希釈せずに施用されるべき、10重量%の活性化合物含量を有する製品を与える。

【0071】

種子の処理のために適当なのは、特にFS製剤である。典型的には、そのようなFS製剤は、1リットル当たり1~800 gの活性化合物、1リットル当たり1~200 gの界面活性剤、1リットル当たり0~200 gの不凍剤、1リットル当たり0~400 gのバインダー、1リットル当たり0~200 gの着色顔料および1リットルまでの溶媒、好ましくは水を含む。

【0072】

活性化合物は、そのまま、その製剤の形態で、またはそれから調製される使用形態で、例えば直接噴霧可能な溶液剤、粉末、懸濁剤もしくは分散製剤、エマルジョン剤、油分散物、ペースト剤、散布可能な製品、散布のための資材、または顆粒剤の形態で、噴霧、霧吹き、振りかけ散布、展着または注入によって、使用することができる。使用形態はもっぱら意図する目的に依存する：各場合において、本発明に係る活性化合物ができる限り

10

20

30

40

50

細かい分布となるように保証することが意図される。

【0073】

水性使用形態は、水を添加することによって、エマルジョン濃縮物、ペーストまたは湿潤性の粉末（噴霧可能な粉末、油分散物）から製造することができる。エマルジョン、ペーストまたは油分散物を製造するために、そのまままたは油もしくは溶媒中に溶解した物質を、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤によって、水中に均質化させることができる。しかしながら、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤および、適当なら溶媒または油からなる濃縮物を製造することもまた可能であり、これら濃縮物は、水で希釈するのに適当である。

【0074】

即時使用可能な調製物中の活性化化合物濃度は、比較的広い範囲内で変化し得る。一般に、0.0001～10%、好ましくは0.01～1%である。

【0075】

活性化化合物はまた、超低体積法(ULV)においてうまく使用することができ、95重量%を超える活性化化合物を含む製剤を施用すること、または添加剤なしで活性化化合物を施用することすら可能である。

【0076】

種々のタイプの油、湿潤剤、補助剤、除草剤、殺菌剤(fungicide)、他の農薬または殺細菌剤(bactericide)を活性化化合物に添加することができ、適当なら、使用する直前まで添加しないことすらできる（タンク混合）。これらの薬剤は典型的には、本発明の組成物と1:100～100:1、好ましくは1:10～10:1の重量比で混合される。

【実施例】

【0077】

使用例

活性化化合物は、ジメチルスルホキシド中10,000 ppmの濃度を有するストック溶液として、別々に製剤した。エポキシコナゾールは、市販の完成された製剤として使用し、水で希釈して活性化化合物を記載された濃度にした。

【0078】

測定されたパラメーターを、活性化化合物を含まない対照群の生育(100%)ならびに菌類および活性化化合物を含まないブランク値と比較して、個々の活性化化合物における病原体の相対的生育(%)を決定した。これらの百分率を、効力に変換した。

【0079】

効力0は、病原体の生育レベルが未処理の対照に匹敵することを意味し、効力100は、病原体が生育していなかったことを意味する。活性化化合物組合せの予想される効力は、コルビーの式(Colby's formula) (Colby, S.R. 「除草剤組合せの相乗作用的および拮抗的応答の計算(Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations)」、Weeds, 第15巻, pp. 20-22, 1967年)を用いて決定し、観察された効力と比較した。

【0080】

コルビーの式 $E = x + y - x \cdot y / 100$

式中、

E 濃度aおよびbで活性化化合物AおよびBの混合物を用いたときの予想される効力（未処理の対照に対する%）、

x 濃度aで活性化化合物Aを用いたときの効力（未処理の対照に対する%）、

y 濃度bで活性化化合物Bを用いたときの効力（未処理の対照に対する%）。

【0081】

実施例1 - マイクロタイタープレート試験におけるセルコスポラ・ソジナ(*Cercospora sojina*)に対する活性

ストック溶液を、比に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで分注し、記載された濃度まで水で希釈した。その後、セルコスポラ・ソジナ(*Cercospora so*

10

20

30

40

50

jina)の胞子の水性バイオモルト(biomalt)溶液懸濁物を添加した。プレートを、18 の温度の水蒸気飽和チャンバーに置いた。接種7日後に、吸光光度計を用いてMTPを405 nmにて測定した。

【表1】

表1

活性化化合物/ 活性化化合物 混合物	濃度 [ppm]	比	観察された 活性 (% 感染)	Colby に従って 計算された活性 (%)
化合物(I)	0.25	---	49	---
化合物(II)	0.25	---	40	---
エポキシコナゾール	0.063	---	32	---
メトコナゾール	0.063	---	40	---
化合物(I) + エポキシコナ ゾール	0.25 + 0.063	4 : 1	99	65
化合物(I) + メトコナゾ ール	0.25 + 0.063	4 : 1	97	69
化合物(II) + エポキシコ ナゾール	0.25 + 0.063	4 : 1	93	59
化合物(II) + メトコナゾ ール	0.25 + 0.063	4 : 1	96	64

【0082】

表1に示された試験結果は、強い相乗作用により、本発明の混合物はコルビーの式を用いて予測されたより著しく活性が高いことを示す。

【0083】

実施例2 - マイクロタイタープレート試験における コリネスポラ・カシイコラ (*Corynespora cassiicola*) に対する活性

ストック溶液を、比に従って混合し、マイクロタイタープレート(MTP)にピペットで分注し、記載された濃度まで水で希釈した。その後、コリネスポラ・カシイコラ (*Corynespora cassiicola*)の胞子の水性バイオモルト(biomalt)溶液懸濁物を添加した。プレートを、18 の温度の水蒸気飽和チャンバーに置いた。接種7日後に、吸光光度計を用いてMTPを405 nmにて測定した。

【表2】

表2

活性化化合物/ 活性化化合物 混合物	濃度 [ppm]	比	観察された 活性 (% 感染)	Colby に従って 計算された活性 (%)
化合物(II)	0.063	---	16	---
メトコナゾール	0.016	---	12	---
化合物(II) + メトコナゾ ール	0.063 + 0.016	1 : 4	50	26

【0084】

表2に示された試験結果は、強い相乗作用により、本発明の混合物はコルビーの式を用

いて予測されたより著しく活性が高いことを示す。

フロントページの続き

- (74)代理人 100111741
弁理士 田中 夏夫
- (72)発明者 グレーガー, ウルフ
ドイツ連邦共和国 6 7 1 4 1 ノイホーフェン, リートブルグシュトラッセ4
- (72)発明者 ストラトマン, ジーグフリード
ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, ズデーテンシュトラッセ2
- (72)発明者 ヴォネンド, ミハエル
ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 パート デュルクハイム, ヴァッサーホール 4 3
- (72)発明者 ハーデン, エゴン
ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 1 ルートヴィヒスハーフェン, バイエルンシュトラッセ 5 5

審査官 目代 博茂

- (56)参考文献 特表2007-509088(JP, A)
米国特許出願公開第2007/0060579(US, A1)
特表2009-509827(JP, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
A01N25/00-65/48