

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4444951号
(P4444951)

(45) 発行日 平成22年3月31日 (2010. 3. 31)

(24) 登録日 平成22年1月22日 (2010. 1. 22)

(51) Int. Cl.

F 1

A O 1 N 25/04 (2006. 01)

A O 1 N 25/04 1 O 2

A O 1 N 41/10 (2006. 01)

A O 1 N 41/10 A

A O 1 N 37/22 (2006. 01)

A O 1 N 37/22

A O 1 N 25/10 (2006. 01)

A O 1 N 25/10

A O 1 N 59/06 (2006. 01)

A O 1 N 59/06

請求項の数 19 (全 16 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2006-504421 (P2006-504421)
 (86) (22) 出願日 平成16年2月13日 (2004. 2. 13)
 (65) 公表番号 特表2006-519792 (P2006-519792A)
 (43) 公表日 平成18年8月31日 (2006. 8. 31)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2004/001377
 (87) 国際公開番号 W02004/080178
 (87) 国際公開日 平成16年9月23日 (2004. 9. 23)
 審査請求日 平成19年2月8日 (2007. 2. 8)
 (31) 優先権主張番号 0305679. 3
 (32) 優先日 平成15年3月12日 (2003. 3. 12)
 (33) 優先権主張国 英国 (GB)

(73) 特許権者 500584309
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アクチエンゲゼルシャフト
 スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 パーゼ
 ル, シュバルツバルトアレー 2 1 5
 (74) 代理人 100099759
 弁理士 青木 篤
 (74) 代理人 100077517
 弁理士 石田 敬
 (74) 代理人 100087871
 弁理士 福本 積
 (74) 代理人 100087413
 弁理士 古賀 哲次
 (74) 代理人 100117019
 弁理士 渡辺 陽一

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草サスポエマルション

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

サスポエマルション製剤であって:

(a) (i) アルキレンオキシドコポリマー、エチレンオキシド-プロピレンブロックコポリマーの $C_2 \sim 6$ アルキル付加体、エチレンオキシド-ブチレンオキシドブロックコポリマーの $C_2 \sim 6$ アルキル付加体、及びポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンモノアルキルエーテルからなる群から選択された 1 又は複数のブロックコポリマー、並びに

(ii) E0-P0ブロックコポリマー、プトキシブロックコポリマー、グラフトくし型ポリマー、ポリエチレングリコールモノエステル及びジエステル、ポリグリセリルアルコールエーテル、アルキルエトキシレート、トリシリルエトキシレート、アルキルアリアルエトキシレート及びアルキルポリグリコシドからなる群から選択された 1 又は複数の非イオン界面活性剤、

を含んで成る連続相;

(b) (i) クロロアセトアミド、及び

(ii) 10,000~1,000,000Daの分子量を有し且つポリプロピレン、ポリイソブチレン、ポリイソブレン、モノオレフィンとジオレフィンのコポリマー、ポリアクリレート、ポリスチレン、ポリビニルアセテート、ポリウレタン及びポリアミドからなる群から選択されたポリマー安定化剤、

を含んで成る分散エマルション相;並びに

(c) (i) 2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオン除草剤;及び

10

20

(ii)安定化金属塩、
を含んで成る分散固相、
を含んで成るサスポエマルション製剤。

【請求項 2】

1 又は複数の更なる活性成分を含んで成る、請求項 1 に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 3】

前記更なる活性成分が除草剤である、請求項 2 に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 4】

前記更なる活性成分がセーフナー又は解毒剤化合物である、請求項 2 に記載のサスポエマルション製剤。 10

【請求項 5】

前記更なる活性成分が除草剤及びセーフナー又は解毒剤化合物を含んで成る、請求項 2 に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 6】

前記連続相が、水、グリコール又はアルコールからなる群から選択されている、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載のサスポエマルション製剤。

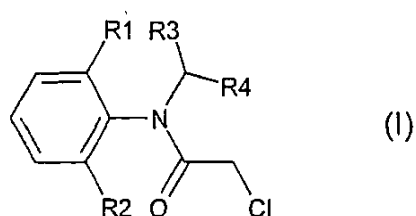
【請求項 7】

前記連続相が水である、請求項 6 に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 8】

前記クロロアセトアミドが式(I)：

【化 1】



(式中、 R^1 は水素、メチル又はエチルであり； R^2 は水素又はエチルであり； R^3 は水素又はメチルであり；そして R^4 はメチル、メトキシ、メトキシメチル、エトキシ、又はブトキシである)

の化合物である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 9】

前記クロロアセトアミドがメトラクロール、アセトクロール及びアラクロールからなる群から選択されている、請求項 8 に記載のサスポエマルション製剤。 40

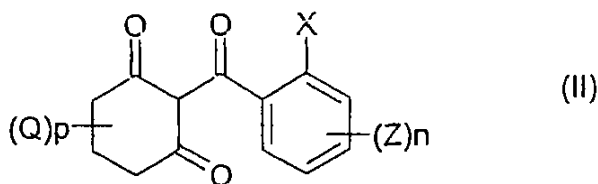
【請求項 10】

前記クロロアセトアミドがs-メトラクロールである、請求項 9 に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 11】

前記2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオン化合物が式(II)：

【化 2】



10

(式中、Xはハロゲン原子;任意に1又は複数の基-OR⁵もしくは1又は複数のハロゲン原子によって任意に置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルキルもしくはアルコキシ基;又はニトロ、シアノ、-CO₂R⁶、-S(O)_mR⁵、-O(CH₂)_rOR⁵、-COR⁶、-NR⁶R⁷、-SO₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、-CSNR⁶R⁷、及び-OSO₂R⁸から選択された基であり;

R⁵は、任意に1又は複数のハロゲン原子によって置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状又は分鎖状のアルキル基を示し;

R⁶及びR⁷は各々独立して、水素原子;又は任意に1又は複数のハロゲン原子によって置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状又は分鎖状のアルキル基を示し;

20

R⁸は1又は複数のハロゲン原子によって任意に置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基;又は炭素原子を3〜6個含むシクロアルキル基を示し;

各Zは独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、S(O)_mR⁹、OS(O)_mR⁹、C₁〜₆アルキル、C₁〜₆アルコキシ、C₁〜₆ハロアルキル、C₁〜₆ハロアルコキシ、カルボキシ、C₁〜₆アルキルカルボニルオキシ、C₁〜₆アルコキシカルボニル、C₁〜₆アルキルカルボニル、アミノ、C₁〜₆アルキルアミノ、各アルキル基において規定数の炭素原子を独立して有するC₁〜₆ジアルキルアミノ、C₁〜₆アルキルカルボニルアミノ、C₁〜₆アルコキシカルボニルアミノ、C₁〜₆アルキルカルボニルアミノ、各アルキル基中に規定数の炭素原子を独立して有するC₁〜₆ジアルキルアミノカルボニルアミノ、C₁〜₆アルコキシカルボニルオキシ、C₁〜₆アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁〜₆ジアルキルカルボニルオキシ、フェニルカルボニル、置換されたフェニルカルボニル、フェニルカルボニルオキシ、置換されたフェニルカルボニルオキシ、フェニルカルボニルアミノ、置換されたフェニルカルボニルアミノ、フェノキシ又は置換されたフェノキシを示し;

30

R⁹は、シアノ、-COR¹⁰、-CO₂R¹⁰又は-S(O)_mR¹¹を示し;

R¹⁰は水素又は炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルキル基を示し;

R¹¹は、C₁〜₆アルキル、C₁〜₆ハロアルキル、C₁〜₆シアノアルキル、ハロゲン、シアノ又はC₁〜₄アルキルにより任意に置換されたC₃〜₈シクロアルキルを示し;又は任意に1〜3個の同じもしくは異なるハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁〜₄ハロアルキル、C₁〜₄アルキル、C₁〜₄アルコキシもしくは-S(O)_mR¹²により置換されたフェニルを示し;

40

R¹²はC₁〜₄アルキルを示し;

Qは各々独立して、C₁〜₄アルキル又は-CO₂R¹³を示し、ここでR¹³はC₁〜₄アルキルであり;

mは0、1又は2であり;

nは0又は1〜4の整数であり;

rは1、2又は3であり;そして

pは0又は1〜6の整数である)

である、請求項1〜10のいずれか1項に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項 1 2】

前記式 (II) の前記2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオンは、2-(2'-ニトロ-

50

4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルオキシベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2'-クロロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、4,4-ジメチル-2-(4-メタンスルホニル-2-ニトロベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2-クロロ-3-エトキシ-4-メタンスルホニルベンゾイル)-5-メチル-1,3-シクロヘキサンジオン及び2-(2-クロロ-3-エトキシ-4-エタンスルホニルベンゾイル)-5-メチル-1,3-シクロヘキサンジオンからなる群から選択されている、請求項1~10のいずれか1項に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項13】

前記2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオンが2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオンである請求項12に記載のサスポエマルション製剤。

10

【請求項14】

前記安定化金属塩が、カルシウム、ベリリウム、バリウム、チタニウム、マグネシウム、亜鉛、鉄、コバルト、ニッケル及び銅の塩である、請求項1~13のいずれか1項に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項15】

前記安定化金属塩が、マグネシウム、マンガン、亜鉛、鉄、コバルト、ニッケル及び銅の塩からなる群から選択されている、請求項14に記載のサスポエマルション製剤。

【請求項16】

前記安定化金属塩が銅塩である、請求項15に記載のサスポエマルション製剤。

20

【請求項17】

不都合な植物の成長を調節するための方法であって、請求項1~16のいずれか1項に記載の製剤をかかす植物のある場所に対して適用することを含んで成る方法。

【請求項18】

不都合な植物の成長を調節するための請求項1~16のいずれか1項に記載のサスポエマルション製剤の使用。

【請求項19】

サスポエマルション製剤であって：

(a)(i) アルキレンオキシドコポリマー、エチレンオキシド-プロピレンブロックコポリマーのC₂~₆アルキル付加体、エチレンオキシド-ブチレンオキシドブロックコポリマーのC₂~₆アルキル付加体、及びポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンモノアルキルエーテルからなる群から選択された1又は複数のブロックコポリマー、並びに

30

(ii) E0-P0ブロックコポリマー、ブトキシブロックコポリマー、グラフトくし型ポリマー、ポリエチレングリコールモノエステル及びジエステル、ポリグリセリルアルコールエーテル、アルキルエトキシレート、トリシリルエトキシレート、アルキルアリアルエトキシレート及びアルキルポリグリコシドからなる群から選択された1又は複数の非イオン界面活性剤、

を含んで成る連続相；

(b)(i) クロロアセトアミド、及び

(ii) 10,000~1,000,000Daの分子量を有し且つポリプロピレン、ポリイソブチレン、ポリイソブレン、モノオレフィンとジオレフィンのコポリマー、ポリアクリレート、ポリスチレン、ポリビニルアセテート、ポリウレタン及びポリアミドからなる群から選択されたポリマー安定化剤、

40

を含んで成る分散エマルション相；並びに

(c)(i) メソトリオン；及び

(ii) 安定化金属塩、

を含んで成る分散固相、

を含んで成るサスポエマルション製剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

50

【0001】

本発明は、活性成分を2種類以上含んで成る新規農芸化学製剤及びその使用に関連する。

【0002】

農薬の製造者は、広範な農薬製品に対する要請を確認している。単一活性成分製剤がかかる広範な要請にみあうことはまれであり、従って、おそらく最大4種類の生物活性成分を含む組み合わせ製品が開発されてきた。かかる製品は、いくつかの更なる利点の例えば、タンク混合の省略;製品在庫の減少;時間と金の節約;並びに作物に噴霧する膨大な時間の低減を有する。

【0003】

かかる製品の開発は比較的単純であるが、ただし、組み合わせられる活性成分は、物理的、化学的及び生物学的に適合性であるべきだ。これらの状況下で、活性成分は、当業界で周知の広範囲の製剤型において組み合わせられて良い。活性成分が、物理的、化学的及び/又は生物学的に適合性がない場合、かかる非適合性に関連した問題を解消するために新規製剤を開発する必要がある。製剤の種類の一つの例は、いわゆる「サスポエマルション製剤」である。これらサスポエマルション製剤は、エマルション相(1又は複数の活性成分を含む)を、固形分散体の形態において1又は複数の活性成分をも含む連続相と組み合わせることによって形成されているこの種類の製剤には、輸送、保存及びフィールド適用の容易さに関連したいくつかのユーザーに対する利点がある。

【0004】

しかし、かかるサスポエマルション製剤の処方は、容易ではない。満足のいく物理的及び化学的安定性を有するサスポエマルション製剤を処方するための技術的挑戦及び複雑さは以前から報告されている(例えば、Suspoemulsion Technology and Trends, Joseph R. Winkle, Pesticide Formulation and Adjuvant Technology, CRC Press, 1996を参照のこと)。

【0005】

本発明の活性成分をサスポエマルションへと処方を試みる場合、特定の問題に出くわす。使用される1つの好適な活性成分は、2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオン)であり、それは遊離酸としてかあるいは金属塩のいずれかににおいて存在していて良い。メソトリオン遊離酸は、ある範囲のpH条件及び/又は濃度の下、水性媒体中で化学的に不安定である。化学的な不安定性の問題は、メソトリオン遊離酸を金属キレート剤の例えば、銅塩又は亜鉛塩によりキレートすることによって解消される。しかし、金属塩を組成物中へと導入することで生じるサスポエマルションの物理的安定性ととも、重度の錯化がもたらされた。キレート化されたメソトリオン粒子は、エマルション相へと移動する(ヘテロフロク化/凝集として知られている現象)ことに気付いた。界面活性系に依存して、このヘテロフロク化/凝集は、瞬間的にマクロスケールで又は比較的ゆっくりと、マクロスケールにおけるストレス下のみで生じうる。これは、非常に異常な挙動であると考えられ、何故なら、それは見掛け上この事象が単なるフロク化(界面に対する界面の)事象ではなく、実際には、エマルション液滴内部へのメソトリオン(mesotriane)の移動だからである。

【0006】

従って、本発明の目的は、2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオン除草剤を活性成分の1つとして含んで成る、化学的及び物理的に安定なエマルション製剤を提供することである。

【0007】

従って、本発明の第一の観点は、サスポエマルション製剤を提供し、当該製剤は:

(a) 連続相であって:

(i) 1又は複数のブロックコポリマー、及び

(ii) 1又は複数の非イオン界面活性剤

を含んで成る連続相;

10

20

30

40

50

(b) 分散したエマルション相であって：

(i) クロロアセトアミド、及び

(ii) ポリマー安定化剤

を含んで成る連続相；並びに

(c) 分散固相であって：

(i) 2-（置換ベンゾイル）-1,3-シクロヘキサンジオン除草剤；及び

(ii) 安定化金属塩、

を含んで成る分散固相、

を含んで成るサスポエマルション製剤を提供する。

【0008】

10

本発明のサスポエマルション製剤は、任意に更に、1又は複数の更なる活性成分を含んで成って良い。1又は複数の更なる活性成分は、農薬の例えば、除草剤、殺真菌剤、殺昆虫剤などであって良い；又は更なる活性成分は、セーフナー（safeners）又は解毒剤として公知のクラスから選択された化合物であって良い。製剤中の活性成分の濃度は、適切に1g/l～500g/lであり、そして好適に2g/l～300g/lである。

【0009】

1つの好適な実施態様において、サスポエマルション製剤は更に、除草剤である更なる活性成分を含んで成り、例えば、トリアジンの例えばアトラジンもしくはテルブチラジン；リン酸塩除草剤の例えば、グリフォセートもしくはその塩；又はフォスフィン酸塩除草剤の例えば、グリフォシネート又はその塩として公知の種類から選択されている。更なる除草剤の濃度は適切に、5g/l～500g/l、そして好適に10g/l～300g/lである。最も好適に、更なる除草剤は、トリアジン、好適にはアトラジン又はテルブチラジンである。適切に、更なる除草剤は、サスポエマルションの分散固相中に存在している。

20

【0010】

第二の好適な実施態様において、サスポエマルション製剤は更に、ペノキサコールなどセーフナー又は解毒剤として公知の種類化合物から選択されている。セーフナーの濃度は、適切に1g/l～100g/lであり、そして好適に2g/l～40g/lである。適切に、セーフナーは、サスポエマルションの分散エマルション相中に存在している。

【0011】

第三の好適な実施態様において、サスポエマルション製剤は、更に活性成分を2種類以上含んで成り、ここで当該更なる活性成分の1つは、除草剤の例えば、トリアジンの例えば、アトラジン又はテルブチラジンであり、そして更なる他の活性成分の1つは、セーフナーの例えば、ペノキサコールである。

30

【0012】

連続相は、任意の適切な溶媒の例えば、水、グリコール又はアルコールであって良いが、好適には水である。

【0013】

本発明において使用されて良い(分散固相中又は分散エマルション相のいずれかにおいて)適切なブロックコポリマーの例としては、アルキレンオキシドコポリマー(例えば、エチレンオキシド-プロピレンオキシドブロックコポリマー、エチレンオキシド-ブチレンオキシドブロックコポリマー)、エチレンオキシド-プロピレンオキシドブロックコポリマーのC₂～₆アルキル付加体、エチレンオキシド-ブチレンオキシドブロックコポリマーのC₂～₆アルキル付加体、ポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンモノアルキルエーテルの例えば、ブチルエーテル、メチルエーテル、プロピルエーテル、エチルエーテル、又はその混合物が挙げられる。ブロックコポリマー及びそれらの使用可能物の更なる例は、当業者に公知である。適切に、本発明のサスポエマルション製剤中のブロックコポリマーの濃度は、0.1～10.0%であり、そして好適には、0.2～7.0%である。

40

【0014】

本発明において使用されて良い非イオン界面活性剤の例は、当業者に公知であり、そして限定されないが、EO-POブロックコポリマー、プトキシブロックコポリマー、グラフト

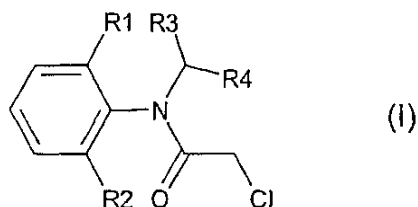
50

くし型ポリマー、ポリエチレングリコールモノエステル及びジエステル、ポリグリセリルアルコールエーテル、アルキルエトキシレート、トリシリルエトキシレート、アルキルアリールエトキシレート及びアルキルポリグリコシドが挙げられる。適切に、本発明のサスポエマルション中の非イオン性界面活性剤の濃度は、0.2～15.0%であり、そして好適に0.5～10.0%である。

【0015】

本発明中で使用するために適したクロロアセトアミドの例は、式(I)：

【化1】



10

(式中、 R^1 は水素、メチル又はエチルであり R^2 は水素又はエチルであり; R^3 は水素又はメチルであり;そして R^4 はメチル、メトキシ、メトキシメチル、エトキシ、又はブトキシである)

20

である。適切に、クロロアセトアミドは、メトラクロール、アセトクロール、及びアラクロールからなる群から選択されており、好適にはメトラクロールであり、そして最も好適には、s-メトラクロールである。適切に、前記サスポエマルション製剤中のクロロアセトアミドの濃度は、100～750g/lであり、一層適切には250～500g/lである。

【0016】

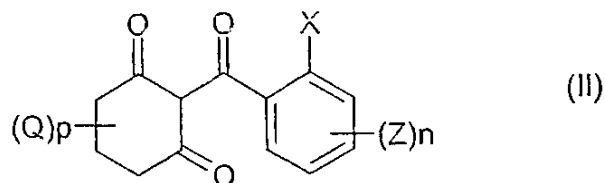
本発明において使用されて良い適切なポリマー安定化剤の例は、分子量10,000～1,000,000Daを有し、そして限定されないが、ポリプロピレン、ポリイソブチレン、ポリイソブレン、モノオレフィンとジオレフィンのコポリマー、ポリアクリレート、ポリスチレン、ポリビニルアセテート、ポリウレタン又はポリアミドが挙げられる。適切に、本発明のサ

30

【0017】

適切に、本発明中で使用するための2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサジオンは式(II)：

【化2】



40

(式中、Xはハロゲン原子;任意に1又は複数の基-OR⁵もしくは1又は複数のハロゲン原子によって任意に置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルコキシもしくはアルキル基;又はニトロ、シアノ、-CO₂R⁶、-S(O)_mR⁵、-O(CH₂)_rOR⁵、-COR⁶、-NR⁶R⁷、-SO₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、-CSNR⁶R⁷及び-OSO₂R⁸から選択された基を示し;

R⁵は、任意に1又は複数のハロゲン原子によって置換されている炭素原子を最大で6個

50

含む直鎖状又は分鎖状のアルキル基を示し；

R^6 及び R^7 は各々独立して、水素原子；又は任意に1又は複数のハロゲン原子によって置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状又は分鎖状のアルキル基を示し；

R^8 は任意に1又は複数のハロゲン原子によって置換されている炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルキル、アルケニルもしくはアルキニル基；又は炭素原子を3～6個含むシクロアルキル基を示し；

各Zは独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、 $S(O)_mR^9$ 、 $OS(O)_mR^9$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、カルボキシ、 $C_1\sim 6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1\sim 6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim 6$ アルキルカルボニル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、各アルキル基において独立して規定数の炭素原子を有する $C_1\sim 6$ ジアルキルアミノ、 C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ、 $C_1\sim 6$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1\sim 6$ アルキルカルボニルアミノ、各アルキル基中に規定数の炭素原子を独立して有する $C_1\sim 6$ ジアルキルアミノカルボニルアミノ、 $C_1\sim 6$ アルコキシカルボニルオキシ、 $C_1\sim 6$ アルキルアミノカルボニルオキシ、 $C_1\sim 6$ ジアルキルカルボニルオキシ、フェニルカルボニル、置換されたフェニルカルボニル、フェニルカルボニルオキシ、置換されたフェニルカルボニルオキシ、フェニルカルボニルアミノ、置換されたフェニルカルボニルアミノ、フェノキシ又は置換されたフェノキシであり；

R^9 はシアノ、 $-COR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 又は $-S(O)_mR^{11}$ を示し；

R^{10} は水素又は炭素原子を最大で6個含む直鎖状もしくは分鎖状のアルキル基を示し；

R^{11} は、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ シアノアルキル、ハロゲン、シアノ又は $C_1\sim 4$ アルキルにより任意に置換された $C_3\sim 8$ シクロアルキルを示し；又は任意に1～3個の同じ又は異なるハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim 4$ ハロアルキル、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシもしくは $-S(O)_mR^{12}$ により置換されたフェニルを示し；

R^{12} は $C_1\sim 4$ アルキルを示し；

Qは各々独立して、 $C_1\sim 4$ アルキル又は $-CO_2R^{13}$ を示し、ここで R^{13} は $C_1\sim 4$ アルキルであり；

mは0、1又は2であり；

nは0又は1～4の整数であり；

rは1、2又は3であり；そして

pは0又は1～6の整数であり；

適切に、Xはクロロ、ブロモ、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $-CF_3$ 、 $-S(O)_mR^5$ 、又は $-OR^5$ であり；

Zは各々独立して、クロロ、ブロモ、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $-CF_3$ 、 $-OR^5$ 、 $-OS(O)_mR^9$ 又は $-S(O)_mR^9$ であり；

nは1又は2であり；そして

pは0である）

の化合物である。

【0018】

好適に、式(II)の2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオンは、2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2'-クロロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、4,4-ジメチル-2-(4-メタンスルホニル-2-ニトロベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオン、2-(2-クロロ-3-エトキシ-4-メタンスルホニルベンゾイル)-5-メチル-1,3-シクロヘキサンジオン及び2-(2-クロロ-3-エトキシ-4-エタンスルホニルベンゾイル)-5-メチル-1,3-シクロヘキサンジオンから成る群から選択されており；最も好適には2-(2'-ニトロ-4'-メチルスルホニルベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオンである。

【0019】

適切に、本発明のサスポエマルション製剤における2-(置換ベンゾイル)-1,3-シクロヘキサンジオンの濃度は、10～100g/lであり、一層適切には25～60g/lである。

【0020】

使用されて良い適切な安定化金属塩の例としては、カルシウム、ベリリウム、バリウム、チタニウム、マグネシウム、マンガン、亜鉛、鉄、コバルト、ニッケル及び銅の塩が挙げられ;最も適切なものは、マグネシウム、マンガン、亜鉛、鉄、コバルト、ニッケル及び銅塩であり;特に好適なものは銅塩であり、例えば、水酸化銅である。適切に、本発明のサスポエマルジョン製剤における安定化金属塩の濃度は0.01~4.0%であり、そして好適には0.02~1.5%である。

【0021】

本発明の更なる観点において、雑草など(天然の手段によって又は遺伝子組み換えによって1又は複数の除草剤に対して耐性を示す)トウモロコシなど所望の植物種の場所の周辺に存在しうる不都合な植物の成長を制御する方法が供されており、当該方法は、本発明の製剤をかかす不都合な植物の場所に対して適用することを含んで成る。代わりに、本発明の更なる観点において、不都合な植物を制御するための本発明の製剤の使用が供されている。不都合な植物の例としては、限定されないが、ベルベツトリフ、アオゲイトウ、通常の水性麻 (common water hemp)、パルマーアマランス (Palmer amaranth)、アメリカアサガオ、アメリカキンゴジカ、オオブタクサ、ブタクサ、オナモミ、イヌホウズキ、シロアカザ、アメリカサナエタデ、ヒマワリ、チョウセンアサガオ、アメリカツノクサネム、トゲのあるトウダイグサ (toothed spurge)、ユベリヒユ、ヒメシバ、キンエノコロ及びコキアが挙げられる。これら雑草は、1又は複数の除草剤に対して耐性を示しても示さなくても(天然に又は遺伝子組換えのいずれかによって)良い。サスポエマルジョン製剤は、穀物が新生する前又は新生する後のいずれかにおいて適用されて良い。好適に、当該製剤は、新生前に適用されている。当該製剤は、空気によって適用されるかあるいは公知の技術の例えば、ハイドロリックノズルスプレーによって地面上に適用されて良い。

【0022】

本発明のサスポエマルジョン製剤の1つの利点とは、大多数の条件下、当該製剤をたった一度適用することによって四季を通じて雑草を長期に渡りコントロールすることができることである。

【0023】

本発明は、例示によってのみ記載されるだろう。

【実施例】

【0024】

実施例11.1 予混合物の調製1.1.1 S-メトラクロールEWの調製

	重量%	
S-メトラクロール [(b)(i)]	66.67	
除草剤解毒剤 (ベノキサコールなど)	3.33	
ポリマー (ポリスチレンなど) [(b)(ii)]	4.18	
ブロックコポリマー (プルロニックP65など) [(a)(i)]	2.13	
シリコーン消泡剤	0.18	40
水	23.51	

【0025】

ポリスチレン及びベノキサコールをs-メトラクロール中に溶かしている。

【0026】

プルロニックP65を水性相中に溶かしそして消泡剤を加えている。この2つを、1~40ミクロンの粒度を有するエマルジョン化した有機相が形成されるように組み合わせている。

【0027】

1.1.2 メソトリオンミルベースの調製

	重量%	
メソトリオン [(c)(i)]	35.00	50

非イオン界面活性剤（16モルのE0を伴うトリスチリルフェノールなど） [(a)(ii)]	2.89
酢酸(56%)	11.01
水酸化銅(100%) [(c)(ii)]	3.50
シリコーン消泡剤	0.10
キサンタンガム	0.10
水	47.40

【0028】

水、酢酸及び水酸化銅と一緒に混合する。メソトリオンを加える。非イオン界面活性剤、消泡剤、及びキサンタンガムを加えて均一になるまで混合する。粒度の中央値が1～6ミクロンになるまで粉碎する。

10

【0029】

1.2 最終産物の調製

	重量%	
S-メトラクロールEW	55.20	
メソトリオンミルベース	10.50	
エチレングリコール	3.00	
非イオン界面活性剤（C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど） [(a)(ii)]	6.00	
ブロックコポリマー（ブチルP0/E0界面活性剤） [(a)(i)]	5.00	
キサンタンガム	0.16	20
防腐剤（ベンゾイソチアゾリノンなど）	0.15	
水	のこり	

【0030】

s-メトラクロールEW、プロピレングリコール、非イオン界面活性剤、ブロックコポリマー及びいくらかの水と一緒に混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。キサンタンガム及び防腐剤を加えて均一に成るまで混合する。もし必要なら、アッセイ及び水による調整を行う。

【0031】

実施例2

2.1予混合物の調製

30

2.1.1 S-メトラクロールEWの調製

	重量%
S-メトラクロール [(b)(i)]	66.67
除草剤解毒剤（ベノキサコールなど）	3.33
ポリマー（ポリスチレンなど） [(b)(ii)]	3.68
ブロックコポリマー（プルロニックF108など） [(a)(i)]	1.00
シリコーン消泡剤	0.18
水	25.14

【0032】

ポリスチレン及びベノキサコールをs-メトラクロール中に溶かしている。

40

【0033】

プルロニックP65を水性相中に溶かし、そして消泡剤を加えている。この2つを、1～40ミクロンの粒度を有するエマルジョン化した有機相が形成されるように組み合わせている。

【0034】

2.1.2 メソトリオンミルベースの調製

	重量%	
メソトリオン [(c)(i)]	35.00	
非イオン界面活性剤（25モルのE0を伴うトリスチリルフェノールなど） [(a)(ii)]	3.50	50

酢酸(56%)	11.01
水酸化銅(100%) [(c)(ii)]	5.00
シリコーン消泡剤	0.10
キサンタンガム	0.10
水	45.29

【0035】

水、酢酸及び水酸化銅を一緒に混合する。メソトリオンを加える。非イオン界面活性剤、消泡剤、及びキサンタンガムを加えて均一になるまで混合する。粒度の中央値が1~6ミクロンになるまで粉碎する。

【0036】

10

2.2 最終産物の調製

	重量%
S-メトラクロールEW	55.20
メソトリオンミルベース	10.50
プロピレングリコール	3.00
非イオン界面活性剤 (C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど) [(a)(ii)]	5.00
ブロックコポリマー (ブチルP0/E0界面活性剤など) [(a)(i)]	6.00
キサンタンガム	0.16
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.15
水	のこり

20

【0037】

s-メトラクロールEW、プロピレングリコール、非イオン界面活性剤、ブロックコポリマー及びいくらかの水を一緒に混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。キサンタンガム及び防腐剤を加えて均一に成るまで混合する。もし必要なら、アッセイ及び水による調整を行う。

【0038】

実施例 33.1 予混合物の調製3.1.1 S-メトラクロールEWの調製

	重量%
S-メトラクロール [(b)(i)]	66.67
除草剤解毒剤 (ベノキサコールなど)	3.33
ポリマー (ポリスチレンなど) [(b)(ii)]	2.12
ブロックコポリマー (プルロニックP68など) [(a)(i)]	1.50
シリコーン消泡剤	0.18
水	26.20

30

【0039】

ポリスチレン及びベノキサコールをs-メトラクロール中に溶かしている。

【0040】

プルロニックP68を水性相中に溶かし、そして消泡剤を加えている。この2つを、1~40ミクロンの粒度を有するエマルジョン化した有機相が形成されるように組み合わせている。

40

【0041】

3.1.2 メソトリオンミルベースの調製

	重量%
メソトリオン [(c)(i)]	35.00
非イオン界面活性剤 (40モルのE0を伴うトリスチリルフェノールなど) [(a)(ii)]	2.89
酢酸(56%)	11.01
水酸化銅(100%) [(c)(ii)]	5.00

50

シリコーン消泡剤	0.10
キサンタンガム	0.10
水	45.90

【0042】

水、酢酸及び水酸化銅を一緒に混合する。メソトリオンを加える。非イオン界面活性剤、消泡剤、及びキサンタンガムを加えて均一になるまで混合する。粒度の中央値が1~6ミクロンになるまで粉碎する。

【0043】

3.2 最終産物の調製

	重量%	10
S-メトラクロールEW	55.20	
メソトリオンミルベース	10.50	
グリセリン	3.00	
非イオン界面活性剤 (C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど) [(a)(ii)]	7.00	
ブロックコポリマー (ブチルPO/E0界面活性剤など) [(a)(i)]	3.00	
キサンタンガム	0.16	
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.15	
水	のこり	

【0044】

s-メトラクロールEW、プロピレングリコール、非イオン界面活性剤、ブロックコポリマー及びいくらかの水を一緒に混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。キサンタンガム及び防腐剤を加えて均一に成るまで混合する。もし必要なら、アッセイ及び水による調整を行う。

【0045】

実施例4

4.1 予混合物の調製

4.1.1 s-メトラクロールEW (3.1.1を参照のこと)

4.1.2 アトラジンミルベース

	重量%	30
アトラジンテクニカル(100%)	57.80	
非イオン界面活性剤 (4~8モルのE0を伴うアルキルエトキシレートなど) [(a)(ii)]	0.58	
E0/PO/E0ブロックコポリマー (プルロニックP38など) [(a)(i)]	1.56	
グリセリン	4.50	
シリコーン消泡剤	0.12	
キサンタンガム	0.05	
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.05	
水	のこり	

【0046】

界面活性剤、エチレングリコール及び水を均一になるまで混合する。消泡剤及びアトラジンを加えて混合する。スラリーを粉碎して、粒度の95%が17ミクロン未満になるようにする。キサンタンガム及び防腐剤を加えて均一に成るまで混合する。

【0047】

4.1.3 メソトリオンミルベース(3.1.2を参照のこと)の調製

4.2 最終製剤の調製

	重量%	50
s-メトラクロールEW	44.1	
グリセリン	4.00	
非イオン界面活性剤 (C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど) [(a)(ii)]	4.50	
ブロックコポリマー (ブチルPQ/E0界面活性剤など) [(a)(i)]	4.50	

メソトリオンミルベース	8.4
アトラジンベースミックス	19.0
キサントガム	0.9
防腐剤（ベンゾイソチアゾリノンなど）	0.9
水	のこり

【0048】

s-メトラクロールEW、水、プロピレングリコール及び界面活性剤を均一になるまで混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。アトラジンベースミックスを、しかる後にキサントガム及び防腐剤を加えて均一になるまで混合する。

【0049】

10

実施例55.1 予混合物の調製5.1.1 s-メトラクロールEW(3.1.1を参照のこと)の調製5.1.2 アトラジンミルベース

	重量%
アトラジテクニカル(100%)	57.80
非イオン界面活性剤（4～8モルのEOを伴うアルキルエトキシレート） [(a)(ii)]	1.15
EO/PO/EOブロックコポリマー（プルロニックP65など） [(a)(i)]	0.70
エチレングリコール	3.00
シリコーン消泡剤	0.12
キサントガム	0.05
防腐剤（ベンゾイソチアゾリノンなど）	0.05
水	のこり

20

【0050】

界面活性剤、エチレングリコール及び水を均一になるまで混合する。消泡剤及びアトラジンを加えて混合する。スラリーを粉碎して、粒度の95%が17ミクロン未満になるようにする。キサントガム及び防腐剤を加えて均一になるまで混合する。

【0051】

5.1.3 メソトリオンミルベース(2.1.2を参照のこと)の調製

30

5.2 最終製剤の調製

	重量%
s-メトラクロールEW	44.1
プロピレングリコール	5.00
非イオン界面活性剤（C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど） [(a)(ii)]	4.00
ブロックコポリマー（ブチルPQ/EO界面活性剤など） [(a)(i)]	5.00
メソトリオンミルベース	8.4
アトラジンベースミックス	19.0
キサントガム	0.9
防腐剤（ベンゾイソチアゾリノン）	0.9
水	のこり

40

【0052】

s-メトラクロールEW、水、プロピレングリコール及び界面活性剤を均一になるまで混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。アトラジンベースミックスを、しかる後にキサントガム及び防腐剤を加えて均一になるまで混合する。

【0053】

実施例66.1 予混合物の調製6.1.1 s-メトラクロールEW(3.1.1を参照のこと)6.1.2 アトラジンミルベース

50

	重量%	
アトラジンテクニカル(100%)	57.80	
非イオン界面活性剤 (4~8モルのEOを伴うアルキルエトキシレート) [(a)(ii)]	1.69	
EO/PO/EOブロックコポリマー (プルロニックP38など) [(a)(i)]	0.40	
エチレングリコール	3.00	
シリコーン消泡剤	0.12	
キサンタンガム	0.05	
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.05	
水	のこり	10

【0054】

界面活性剤、エチレングリコール及び水を均一になるまで混合する。消泡剤及びアトラジンを加えて混合する。スラリーを粉碎して、粒度の95%が17ミクロン未満になるようにする。キサンタンガム及び防腐剤を加えて均一になるまで混合する。

【0055】

6.1.3 メソトリオンミルベース(1.1.2を参照のこと)の調製

5.2 最終製剤の調製

	重量%	
s-メトラクロールEW	44.1	
グリセリン	5.00	20
非イオン界面活性剤 (C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど) [(a)(ii)]	3.00	
ブロックコポリマー (ブチルPQ/EO界面活性剤など) [(a)(i)]	6.00	
メソトリオンミルベース	8.4	
アトラジンベースミックス	19.0	
キサンタンガム	0.9	
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.9	
水	のこり	

【0056】

s-メトラクロールEW、水、プロピレングリコール及び界面活性剤を均一になるまで混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。アトラジンベースミックスを、しかる後にキサンタンガム及び防腐剤を加えて均一になるまで混合する。

【0057】

実施例7

7.1 予混合物の調製

7.1.1 メトラクロールEW

	重量%	
メトラクロール [(b)(i)]	66.67	
除草剤解毒剤 (ベノキサコールなど)	3.33	
ポリマー (ポリスチレンなど) [(b)(ii)]	4.18	
ブロックコポリマー (プルロニックF108など) [(a)(i)]	1.87	40
シリコーン消泡剤	0.18	
水	23.77	

【0058】

ポリスチレン及びベノキサコールをメトラクロール中に溶かしている。

【0059】

プルロニックF108を水性相中で溶かしそして消泡剤を加えている。この2つを粒度1~40ミクロンを有するエマルジョン化された有機相が形成されるように組み合わせる。

【0060】

7.1.2 アトラジンミルベース(6.1.2を参照のこと)

7.1.3 アトラジンミルベース(6.1.2を参照のこと)の調製

7.2 最終製剤の調製

	重量%	
メトラクロールEW	44.1	
グリセリン	5.00	
非イオン界面活性剤 (C ₉ -C ₁₁ アルキルポリグリコシドなど) [(a)(ii)]	3.00	
ブロックコポリマー (ブチルPQ/E0界面活性剤など) [(a)(i)]	6.00	
メソトリオンミルベース	8.4	
アトラジンベースミックス	19.0	
キサンタンガム	0.9	
防腐剤 (ベンゾイソチアゾリノンなど)	0.9	10
水	のこり	

【0061】

メトラクロールEW、水、プロピレングリコール及び界面活性剤を均一になるまで混合する。メソトリオンミルベースを加えて混合する。アトラジンベースミックスを、しかる後にキサンタンガム及び防腐剤を加えて均一に成るまで混合する。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A O 1 N 59/16 (2006.01) A O 1 N 59/16 Z
A O 1 P 13/00 (2006.01) A O 1 P 13/00
A O 1 N 43/82 (2006.01) A O 1 N 43/82 1 O 1 B

(74)代理人 100082898

弁理士 西山 雅也

(72)発明者 クシュ, サラ ベス

アメリカ合衆国, ノースカロライナ 27409, グリーنزボロ, スウィング ロード 410
, シンジェンタ クロップ プロテクション, インコーポレイティド

(72)発明者 ホプキンソン, マイケル ジェイムズ

アメリカ合衆国, ノースカロライナ 27409, グリーنزボロ, スウィング ロード 410
, シンジェンタ クロップ プロテクション, インコーポレイティド

審査官 野口 勝彦

(56)参考文献 国際公開第02/067682 (WO, A1)

米国特許第05912207 (US, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 25/00-65/02

CA/REGISTRY(STN)