

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2013-526492

(P2013-526492A)

(43) 公表日 平成25年6月24日(2013.6.24)

(51) Int.Cl.	F 1	テーマコード (参考)
<b>AO1N 25/30</b>	(2006.01)	AO1N 25/30
<b>AO1N 43/54</b>	(2006.01)	AO1N 43/54
<b>AO1N 57/16</b>	(2006.01)	AO1N 57/16
<b>AO1N 43/653</b>	(2006.01)	AO1N 43/653
<b>AO1P 3/00</b>	(2006.01)	AO1P 3/00

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 25 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2013-509457 (P2013-509457)	(71) 出願人	505066718 コグニス・アイピー・マネージメント・ゲ ゼルシャフト・ミット・ペシュレンクテル ・ハフツング Cognis IP Management GmbH ドイツ連邦共和国, 40589デュッセル ドルフ, ヘンケルストラーゼ, 67
(86) (22) 出願日	平成23年3月30日 (2011.3.30)	(74) 代理人	100081422 弁理士 田中 光雄
(85) 翻訳文提出日	平成25年1月8日 (2013.1.8)	(74) 代理人	100101454 弁理士 山田 卓二
(86) 國際出願番号	PCT/EP2011/001579	(74) 代理人	100104592 弁理士 森住 憲一
(87) 國際公開番号	W02011/141093		
(87) 國際公開日	平成23年11月17日 (2011.11.17)		
(31) 優先権主張番号	EP10004859		
(32) 優先日	平成22年5月8日 (2010.5.8)		
(33) 優先権主張国	歐州特許庁 (EP)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】アルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含むバイオサイド組成物

## (57) 【要約】

(a) アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、(b) バイオサイド、および任意に、(c) 油成分または共溶媒および/または(d) 乳化剤を含むバイオサイド組成物を提案する。本発明の組成物は、優れた補助特性を示す。

## 【特許請求の範囲】

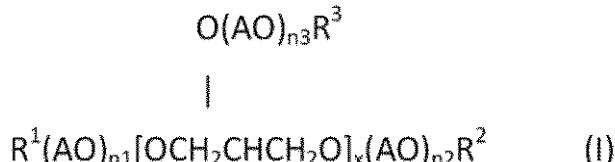
## 【請求項 1】

- (a) アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、
  - (b) バイオサイド、および任意に、
  - (c) 油成分または共溶媒および／または
  - (d) 乳化剤
- を含む、バイオサイド組成物。

## 【請求項 2】

成分(a)として一般式(I)：

## 【化 1】



[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、基R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の少なくとも1つは水素と異なるという条件で、独立して、水素、または、2～22個の炭素原子および3個以下の二重結合を有する、飽和または不飽和、直鎖状または分枝状の、任意にヒドロキシ置換されたアシル基のいずれかを表し、AOは、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドおよびそれらの混合物から選択されるアルキレンオキシド単位を表し、n<sub>1</sub>、n<sub>2</sub>およびn<sub>3</sub>は、独立して、合計(n<sub>1</sub>+n<sub>2</sub>+n<sub>3</sub>)は10～200の範囲の整数であるという条件で、1～100の範囲の整数を意味し、xは、1.1～10の範囲の整数を意味する]

で示されるアルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含むことを特徴とする、請求項1に記載の組成物。

## 【請求項 3】

成分(a)としてエトキシ化オリゴグリセロールエステルを含むことを特徴とする、請求項1または2に記載の組成物。

## 【請求項 4】

成分(a)として飽和および不飽和の植物脂肪酸から誘導したアルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含むことを特徴とする、請求項1～3のいずれかに記載の組成物。

## 【請求項 5】

除草剤、殺菌剤、殺虫剤および植物成長調整剤からなる群から選択されるバイオサイド(成分b)を含むことを特徴とする、請求項1～4のいずれかに記載の組成物。

## 【請求項 6】

アゾール、ストロビルリン、ジフェニルエーテル、アニリド、有機ホスフェート、合成功レトロイド、ネオニコチノイド、オキサジアジン、ベンゾイル尿素、フェニルカルバメート、クロロアセトアミド、トリケトン、ピリジンカルボン酸、シクロヘキサンジオンオキシム、フェニルピラゾール、グリホサートおよびその塩、ならびにこれらの混合物からなる群から選択されるバイオサイド(成分b)を含むことを特徴とする、請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

## 【請求項 7】

オキシフルロフェン、プロパニル、クロルピリホス、ビフェントリン、デルタメトリン、アゾキシストロピン、クレスキシム-メチル、ラムダ-シハロトリン、ノバルロン、ルフェヌロン、イミダクロプリド、チアクロプリド、インドキサカルブ、オキシフルオルフェン、フルロキシピルおよびそのエステル、フェンメジファム、デスマジファム、アセトクロル、テブコナゾール、エポキシコナゾール、プロピコナゾール、フェンプロコナゾール、トリアジメノール、フィプロニル、ならびにこれらの混合物からなる群から選択されるバイオサイド(成分b)を含むことを特徴とする、請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

10

20

30

40

50

**【請求項 8】**

6～18個の炭素原子を有する脂肪アルコールに基づくゲルベアルコール、直鎖状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪アルコールとのエステルまたは分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>1</sub>～カルボン酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪アルコールとのエステル、C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪酸のメチルエステル、直鎖状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪酸と分枝状アルコールとのエステル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>～アルキルヒドロキシカルボン酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪アルコールとのエステル、直鎖状および/または分枝状脂肪酸と多価アルコールおよび/またはゲルベアルコールとのエステル、C<sub>6</sub>-C<sub>1</sub>～脂肪酸に基づくトリグリセリド、C<sub>6</sub>-C<sub>1</sub>～脂肪酸に基づく液体のモノ-/ジ-/トリグリセリド混合物、C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪アルコールおよび/またはゲルベアルコールと芳香族カルボン酸とのエステル、C<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>～ジカルボン酸と1～22個の炭素原子を有する直鎖状または分枝状アルコールまたは2～10個の炭素原子および2～6個のヒドロキシル基を有するポリオールとのエステル、植物油、分枝状第一級アルコール、置換シクロヘキサン、直鎖状および分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～脂肪アルコールカーボネット、6～18個、好ましくは8～10個の炭素原子を有する脂肪アルコールに基づくゲルベカーボネット、モノプロピレングリコールとC<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>～酸および安息香酸とのエステル、安息香酸と直鎖状および/または分枝状C<sub>6</sub>-C<sub>2</sub>～アルコールとのエステル、アルキル基あたり6～22個の炭素原子を有する直鎖状または分枝状、対称または非対称ジアルキルエーテル、エポキシ化脂肪酸エステルのポリオールによる開環生成物、シリコーン油および/または脂肪族またはナフテン系炭化水素、鉱物油、ならびにそれらの混合物からなる群から選択される油成分または共溶媒(成分c)を含むことを特徴とする、請求項1～7のいずれかに記載の組成物。  
10

**【請求項 9】**

該油成分はエステル構造を示すことを特徴とする、請求項1～8のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 10】**

該油成分は、アジピン酸エステル、乳酸エステル、植物油のメチルエステル、および、アルキルエステルからなる群から選択されることを特徴とする、請求項1～9のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 11】**

非イオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤およびそれらの混合物からなる群から選択される乳化剤(成分d)を含むことを特徴とする、請求項1～10のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 12】**

- (a) アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、0.1～99重量%、
- (b) バイオサイド、1～99.1重量%、
- (c) 油成分または共溶媒、0～50重量%、および
- (d) 乳化剤、0～15重量%

を、任意に水と共に数値が合計して100重量%となるという条件で含むことを特徴とする、請求項1～11のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 13】**

バイオサイド用の補助剤としての、アルコキシ化オリゴグリセロールエステルの使用。

**【請求項 14】**

タンク混合または缶製剤において該補助剤を使用することを特徴とする、請求項14に記載の使用。

**【発明の詳細な説明】**

**【技術分野】**

**【0001】**

本発明は農薬の分野に関し、アルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含むバイオサイド組成物およびそのバイオサイド用補助剤としての使用に関する。

**【背景技術】**

10

20

30

30

40

50

## 【0002】

作物を守り、作物の質および収穫高を高めるために、バイオサイド、特に殺菌剤、殺虫剤および除草剤などの駆除剤は、農業における重要な補助剤である。種々の要求、時に非常に特異的な要求に応じて、非常に異なる化学的構造および性質を示す、活性物質の等級が存在する。それにも関わらず、特に非常に低温または高温で長期間貯蔵した場合に、満足する安定性を示すこれらの活性物質の液状組成物を調製することが依然として困難であることは、技術水準からよく知られている。貯蔵安定性および安定なタンク混合物を製造する能力に加えて、添加剤および補助剤の生物学的特性への影響の重要性が高い。それらの選択は、製造のしやすさ、低い毒性および低い生態毒性、それらの相溶性（例えば乳化性濃縮物（E C）、水中油型エマルジョン（E W）、サスペンション（S E）および水中濃縮懸濁液（S C）または油中濃縮懸濁液の製剤など）といった、数多くの追加的パラメーターによって決定される。

10

## 【0003】

エトキシ化ポリオールエステルは、農薬用途において、長きにわたり添加剤および補助剤として知られている。例えばドイツ民主共和国D D 2 6 8 1 4 7 A 1号には、除草剤（特にプロモキシニルカリウム塩）用の補助剤としてのエトキシ化大豆油の使用が記載されている。国際公開第96/022109号（S E P P I C）には、駆除剤および医薬品製剤用の原料としてのエトキシ化ポリオールエステル群の請求項が記載されている。最後に、いずれも花王株式会社に割り当てられる欧州特許第0539980号および欧州特許第0765602号には、他の非イオン性界面活性剤との組み合わせにおける、特に除草剤および植物成長促進剤用の補助剤としての、ジグリセロールエステルおよびオリゴグリセロールエステルが開示されている。しかしながら、これらの補助剤はいずれも、異なるバイオサイドの広範囲におよび満足のいく性能を示すものではない。

20

## 【先行技術文献】

## 【特許文献】

## 【0004】

【特許文献1】ドイツ民主共和国D D 2 6 8 1 4 7 A 1号明細書

30

【特許文献2】国際公開第96/022109号パンフレット

【特許文献3】欧州特許第0539980号明細書

【特許文献4】欧州特許第0765602号明細書

## 【発明の概要】

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0005】

したがって、本発明の根本的な課題は、現在技術の欠点を克服することである。特に、種々のバイオサイドの性能、および、より長い貯蔵時間および異なる貯蔵温度の経過後における組成物の高い安定性をも補助し高めるために、すぐれた補助剤特性を有する農業用組成物用の新規な添加剤を提供することが課題であった。

## 【課題を解決するための手段】

## 【0006】

本発明は、

40

(a) アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、

(b) バイオサイド、および任意に、

(c) 油成分および／または共溶媒および／または

(d) 乳化剤

を含むバイオサイド組成物に関する。

## 【0007】

驚くべきことに、アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、特に不飽和脂肪酸に基づくエトキシ化ジグリセロールエステルは、類似の非アルコキシ化化合物と比較して、優れた補助特性を示すことが認められた。本発明の生成物は、多くの水性バイオサイド製剤、特に例えばグリホサートまたはエポキシコナゾールのような既知のバイオサイドの雑草防

50

除特性を改善する。本発明のアルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含む組成物は、特に獣脂アミンエトキシレートと比較して、より良好な貯蔵安定性をも示す。

【発明を実施するための形態】

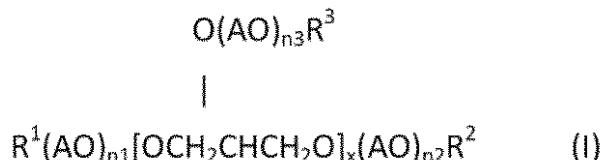
【0008】

〔アルコキシ化オリゴグリセロールエステル〕

オリゴグリセロールエステルおよびそれらのアルコキシ化生成物は、有機化学の一般的な方法、例えば関連するアルコキシ化オリゴグリセロールと脂肪酸または脂肪酸メチルエステルとの直接エステル化またはエステル交換により得られる、既知の非イオン性界面活性剤を表す。本発明の化合物(a)を形成するアルコキシ化オリゴグリセロールエステルは、通常、一般式(I)：

【0009】

【化1】



[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、基R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の少なくとも1つは水素と異なるという条件で、独立して、水素、または、2～22個、好ましくは6～22個、より好ましくは16～18個の炭素原子および3個以下の二重結合を有する、飽和または不飽和、直鎖状または分枝状の、任意にヒドロキシ置換されたアシル基のいずれかを表し、AOは、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドおよびそれらの混合物から選択されるアルキレンオキシド単位を表し、n<sub>1</sub>、n<sub>2</sub>およびn<sub>3</sub>は、独立して、合計(n<sub>1</sub>+n<sub>2</sub>+n<sub>3</sub>)は約10～約200の範囲の整数であるという条件で、1～約100の範囲の整数を意味し、xは、1.1～10の範囲の整数を意味する]

に従う。

【0010】

式(I)が示すように、以下の構造特性の1つ以上を変更することにより分子を改変することができるため、アルコキシ化オリゴグリセロールエステルは幅広い範囲の種類に及ぶ：

- ・グリセロール骨格のオリゴマー化度、
- ・アルコキシ化の種類および程度、
- ・脂肪酸部分の種類、および
- ・エステル化度。

【0011】

本発明に関して、オリゴグリセロールは、例えば高温度条件下でのグリセロールのアルカリ性縮合またはエピクロルヒドリンの重縮合により得られる、グリセロールオリゴマーを意味する。該オリゴマーは、直鎖状または分枝状のいずれか、または、環状であってさえよい。平均オリゴマー化度は、1.1～10、好ましくは1.5～5、より好ましくは2～4である。明確性の理由のために、オリゴマー化度は平均値を表すことに注意すべきである。例えば1.1のオリゴマー化度は、約90%の未反応グリセロールおよび10%の高級オリゴマー(特にジグリセロール)を含む混合物が得られたことを意味する。本発明のジグリセロールエステルは、通常、ジグリセロールエステル約90%および高級オリゴマー10%、または、1～6、好ましくは平均して2の重合度を有するオリゴマー化グリセロールの原料混合物のいずれかを含む。

【0012】

アルキレンオキシド単位に関する限り、エトキシレート、プロポキシレート、ブトキシレートまたはそれらの混合物を適用してよいことを記載する。ポリアルキレングリコール鎖は、これらの単位をブロック状またはランダム分布で含んでよい。本発明のオリゴグリセロールエステルは200個以下のアルキレンオキシド単位を含有することが可能であ

10

20

30

40

50

る。しかしながら、好ましい種類は、5～50個、より具体的には10～15個のアルキレンオキシド単位（好ましくはエチレンオキシド単位）を含有する。

#### 【0013】

分子の親油性部分を形成する脂肪酸は、短鎖カルボン酸、中鎖脂肪酸または長鎖脂肪酸、例えば酢酸、プロピオン酸、酪酸、カプリン酸、カブリル酸、カブロン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、12-ヒドロキシステアリン酸、イソステアリン酸、ベヘン酸およびそれらの混合物から誘導することができる。しかしながら、好ましくは、例えばオレイン酸、エライジン酸、リノール酸、リノレイン酸、共役リノレン酸、リシノール酸および例えばヒマワリ油、高オレイン酸ヒマワリ油（HOSO）、ライン種子油（line seed oil）、オリーブ油などから得られる工業グレード混合物を含む、それらの混合物などの不飽和脂肪酸である。10

#### 【0014】

アルコキシ化オリゴグリセロールエステルは、完全にまたは部分的にエステル化されていてよい。1～3、特に約2のエステル化度を示す種類が好ましい。エステル化度も平均値を表すことを理解すべきである。特に好ましい本発明の種類は、以下のいずれかである：20

- ・ジグリセロールエステル、
- ・エトキシ化オリゴグリセロールエステル、または
- ・飽和および不飽和脂肪酸から誘導したアルコキシ化オリゴグリセロールエステル。

#### 【0015】

これら3つの特徴の全てを組み合わせた種類、即ち飽和および不飽和脂肪酸から誘導したエトキシ化ジグリセロールエステルは、もちろん特に好ましい。20

#### 【0016】

##### 〔バイオサイド〕

バイオサイド（本発明に関し、バイオ活性剤（成分b）とも称される）は、植物保護剤、より具体的には医薬、農業、林業および蚊駆除などの分野において使用される異なる形態の生命体を殺すことができる化学物質である。いわゆる植物成長調整剤もバイオサイドの群としてみなされる。通常、バイオサイドは次の2つの下位群に分けられる：

・殺菌剤（fungicides）、除草剤、殺虫剤、除藻剤、軟体動物駆除剤、殺ダニ剤および殺鼠剤を包含する駆除剤（ここで、「The Pesticide Manual（農薬便覧）」、第14版、BCPC 2006が参考として挙げられ、これは、個々の活性成分の作用方法についての情報を提供する）、ならびに30

・殺菌剤（germicides）、抗生物質、抗細菌薬、抗ウィルス薬、抗真菌薬、抗原虫薬および抗寄生虫薬を包含する抗菌剤。

#### 【0017】

バイオサイドを他の物質（通常は液体）に添加してよく、物質を生物的汚染および成長から保護する。例えば、ある種の第四級アンモニウム化合物（クオート）を、プール用水または工業用水系に添加してよく、除藻剤として作用し、藻類の侵入および増殖から水を保護することができる。40

#### 【0018】

##### a ) 駆除剤

米国環境保護庁（EPA）は、駆除剤を「いずれかの有害生物を防止し、破壊し、撃退し、または軽減することを目的としたいずれかの物質または物質の混合物」として定義している。駆除剤は、ヒトと食物を争い、特性を破壊し、疾患を蔓延させ、または有害である昆虫、植物病原菌、雑草、軟体動物、鳥類、哺乳類、魚類、線形動物（回虫）および微生物を含む有害生物に対して用いられる化学物質または生物学的薬剤（例えばウイルスまたは細菌など）であってよい。以下の例では、本発明の農薬組成物に適当な駆除剤を示す。50

#### 【0019】

##### b ) 殺菌剤

殺菌剤は、有害生物駆除（この場合は菌類の化学的駆除）の3つの主要な方法の1つである。殺菌剤は、庭園や作物に菌類が蔓延するのを防止するために使用される化合物である。殺菌剤は、真菌感染に対抗するためにも使用される。殺菌剤は、接触性または浸透性のいずれかであり得る。接触性殺菌剤は、菌類の表面に噴霧された場合に菌類を死滅させる。浸透性殺菌剤は、菌類が死滅する前に菌類に吸収させねばならない。本発明の適当な殺菌剤の例は、以下の化学種および対応する例を包含する：

- ・アミノピリミジン、例えばブピリメートなど、10
- ・アニリノピリミジン、例えばシプロジニル、メパニビルム、ピリメタニルなど、10
- ・ヘテロ芳香族、例えばヒメキサゾールなど、10
- ・ヘテロ芳香族炭化水素、例えばエトリジアゾールなど、10
- ・クロロフェニル／ニトロアニリン、例えばクロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホス-メチルなど、10
- ・ベンズアミド殺菌剤、例えばゾキサミドなど、10
- ・ベンゼンスルホンアミド、例えばフルスルファミドなど、10
- ・ベンズイミダゾール、例えばアシベンゾラル、ベノミル、ベンゾチアゾール、カルベンダジム、フベリダゾール、メトラフェノン、プロベナゾール、チアベンダゾール、トリアゾキシドなど、およびベンズイミダゾール前駆体殺菌剤10
- ・カルバメート、例えばプロパモカルブ、ジエトフェンカルブなど、10
- ・カルボキサミド、例えばボスカリド、ジクロシメット、エタボキサム、フルトラニル、ペンチオピラド、チフルザミドなど、10
- ・クロロニトリル、例えばクロロタロニルなど、10
- ・ケイ皮酸アミド、例えばジメトモルフ、フルモルフなど、10
- ・シアノアセトアミドオキシム、例えばシモキサニルなど、10
- ・シクロプロパンカルボキサミド、例えばカルプロパミドなど、10
- ・ジカルボキシイミド、例えばイプロジオン、オクチリノン、プロシミドン、ビンクロゾリンなど、10
- ・ジメチルジチオカルバメート、例えばフェルバム、メタム、チウラム、ジラムなど、10
- ・ジニトロアニリン、例えばフルアジナムなど、10
- ・ジチオカルバメート、例えばマンカッパー、マンゼブ、マネブ、メチラム、ナバム、プロピネブ、ジネブなど、10
- ・ジチオラン、例えばイソプロチオランなど、10
- ・グルコピラノシリル抗菌剤、例えばストレプトマイシン、バリダマイシンなど、10
- ・グアニジン、例えばドジン、グアザチン、イミノクタジンなど、10
- ・ヘキソピラノシリル抗菌剤、例えばカスガマイシンなど、10
- ・ヒドロキシアニリド、例えばフェンヘキサミドなど、10
- ・イミダゾール、例えばイマザリル、オキシポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾールなど、10
- ・イミダゾリノン、例えばフェンアミドなど、10
- ・無機物、例えばボルドー混液、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅(II)、硫酸銅、酢酸銅(II)、炭酸銅(II)、亜酸化銅、硫黄など、40
- ・イソベンゾフラノン、例えばフタリドなど、40
- ・マンデラミン、例えばマンジプロパミドなど、40
- ・モルホリン、例えばドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン、アルジモルフなど、40
- ・有機スズ、例えばフェンチンなど、40
- ・オキサゾジリノン、例えばオキサジキシルなど、40
- ・フェニルアミド、例えばベナラキシル、ベナラキシル-M、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル-M、オフラセなど、40
- ・フェニルピラゾール、例えばフィプロニルなど、40
- ・フェニルピロール、例えばフルジオキソニルなど、40

- ・フェニル尿素、例えばベンシクロンなど、
  - ・ホスホネート、例えばホセチルなど、
  - ・フタルアミド酸、例えばテクロフタラムなど、
  - ・フタルイミド、例えばキャプタホール、キャプタン、ホルペットなど、
  - ・ピペラジン、例えばトリホリンなど、
  - ・プロピオンアミド、例えばフェノキサニルなど、
  - ・ピリジン、例えばピリフェノックスなど、
  - ・ピリミジン、例えばフェナリモル、ヌアリモルなど、
  - ・ピロロキノリノン、例えばピロキロンなど、
  - ・キル (Quins)、例えばシアゾファミドなど、
  - ・キナゾリノン、例えばプロキナジドなど、
  - ・キノリン、例えばキノキシフェンなど、
  - ・キノン、例えばジチアノンなど、
  - ・スルファミド、例えばトリルフルアニド、ジクロフルアニドなど、
  - ・ストロビルリン、例えばアゾキシストロビン、ジモキシストロビン、ファモキサドン、フルオキサストロビン、クレソキシム - メチル、メトミノストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、オリサストロビンなど、
  - ・チオカルバメート、例えばメタスルホカルブなど、
  - ・チオファネート、例えばチオファネート - メチルなど、
  - ・チオフェンカルボキサミド、例えばシルチオファムなど、
  - ・トリアゾール殺菌剤、例えばアザコナゾール、ビテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリニアホール、フルオトリマゾール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、キンコナゾールなど、
  - ・トリアゾロベンゾチダゾール (Triazolobenzothiadiazoles)、例えばトリシクラゾールなど、
  - ・バリニアミドカルバメート、例えばイプロバリカルブ、ベンチアバリカルブなど、
  - ・フルオピコリド、
  - ・ペンタクロロフェノール、
- ならびにそれらの混合物。

#### 【 0 0 2 0 】

#### c ) 除草剤

除草剤は、望ましくない植物を死滅させるために使用される駆除剤である。選択的な除草剤は特定の標的を死滅させる一方、所望の植物を相対的に無傷のままに残す。これらのいくつかは、雑草の成長を妨害することにより作用し、しばしば植物ホルモンに基づく。荒地をきれいにするために使用される除草剤は、非選択的であり、それが接触したすべての植物体を死滅させる。除草剤は農業および造園の芝生管理において広く使用されている。それらは、幹線道路および鉄道を整備するための全体的な植生管理 (TVC) プログラムに適用される。林業、牧草系および野生生物生息地として割り当てられている領域の管理においては、より少ない量で使用される。一般的に、あらゆる化学種および対応する例を含む活性成分を使用することができる：

- ・アニリド、例えばプロパニルなど、
- ・アリールオキシカルボン酸、例えばMCPA - チオエチルなど、
- ・アリールオキシフェノキシプロピオネート、例えばクロジナホップ - プロバルギル、シハロホップ - ブチル、ジクロホップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、キザロホップなど、
- ・クロロアセトアミド、例えばアセトクロル (acetochlor)、アラクロル、ブタクロル

- 、ジメテナミド、メトラクロル、プロパクロルなど、
- ・シクロヘキサンジオンオキシム、例えばクレトジム、セトキシジム、トアルコキシジムなど、
- ・ベンズアミド、例えばイソキサベンなど、
- ・ベンゾイミダゾール、例えばジカンバ、エトフメサートなど、
- ・ジニトロアニリン、例えばトリフルラリン、ペンジメタリンなど、
- ・ジフェニルエーテル、例えばアクロニフェン、オキシフルオルフェンなど、
- ・グリシン誘導体グリホサート、無耕農業のバーンダウンおよびその効果に抵抗するために遺伝的に変性させた作物の雑草防除用に用いられる浸透性非選択的（あらゆるタイプの植物を死滅させる）除草剤、

10

- ・ヒドロキシベンゾニトリル、例えばプロモキシニルなど、
- ・イミダゾリノン、例えばフェナミドン、イマザピック、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキンなど、
- ・イソオキサゾリジノン、例えばクロマゾンなど、
- ・パラコート、例えばビピリジリウムなど、
- ・フェニルカルバメート、例えばデスマジファム、フェンメジファムなど、
- ・フェニルピラゾール、例えばピラフルフェン-エチルなど、
- ・フェニルピラゾリン、例えばピノキサデンなど、
- ・ピリジンカルボン酸または合成オーキシン、例えばピクロラム、クロピラリド、およびトリクロピルなど、
- ・ピリミジニルオキシベンゾイック、例えばビスピリバック-ナトリウム (bispyribac-sodium) など、

20

- ・スルホニル尿素、例えばアミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、クロルスルフロン、フラザスルフロン、ホラムスルフロン、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム、ニコスルフロン、リムスルフロン、スルホスルフロン、トリベヌロン-メチル、トリフロキシスルフロン-ナトリウム、トリフルスルフロン、トリトスルフロンなど、

30

- ・トリアゾロピリミジン、例えばペノキスラム、メトスラム、フロラスラムなど、
  - ・トリケトン、例えばメソトリオン、スルコトリオンなど、
  - ・尿素、例えばジウロン、リニュロンなど、
  - ・フェノキシカルボン酸、例えば 2 , 4 - D、M C P A、M C P B、メコプロップなど、
  - ・トリアジン、例えばアトラジン、シマジン、テルブチラジンなど、
- ならびにそれらの混合物。

#### 【 0 0 2 1 】

##### d ) 殺虫剤

殺虫剤は、あらゆる発育型における昆虫に対して使用される駆除剤である。それらは、昆虫の卵および幼虫に対して用いられる殺卵剤および幼虫駆除剤を含む。殺虫剤は農業、医薬、産業および家庭で用いられる。以下に、殺虫剤の適当な化学種および例を挙げる：

- ・アバメクチン、エマメクチンなど、
- ・アントラニル酸ジアミド、例えばリナキシビルなど、
- ・合成オーキシン、例えばアベルメクチンなど、
- ・アミジン、例えばアミトラズなど、
- ・アントラニル酸ジアミド、例えばリナキシビルなど、
- ・カルバメート、例えばアルジカルブ、カルボフラン、カルバリル、メトミル、2 - ( 1 - メチルプロピル ) フェニルメチルカルバメートなど、
- ・塩素系殺虫剤、例えば、カンフェクロール、D D T、ヘキサクロロシクロヘキサン、ヘキサクロロシクロヘキサン、メトキシクロル、ペンタクロロフェノール、T D E、アルドリン、クロルデン、クロルデコン、ディルドリン、エンドスルファン、エンドリン、ヘプタクロル、マイレックスなど、
- ・幼若ホルモン類似体、例えばピリプロキシフェンなど、

40

50

- ・ネオニコチノイド、例えばイミダクロプリド、クロチアニジン、チアクロプリド、チアメトキサムなど、
- ・有機リン化合物、例えばアセフェート、アジンホス - メチル、ベンスリド、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス (D D V P)、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エトプロップ (dthoprop)、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、マラチオン、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メビンホス、ナレッド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラチオン、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホステブピリム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、トリブホス、トリクロルホンなど、10
- ・オキサジアジン、例えばインドキサカルブなど、
- ・植物毒素由来化合物、例えばデリス (ロテノン)、除虫菊、ニーム (アザジラクチン)、ニコチン、カフェインなど、
- ・フェロモン、例えばクエルア (cuellure)、メチルオイゲノールなど、
- ・ピレスロイド、例えば、アレスリン、ビフェントリン、デルタメトリン、ペルメトリン、レスメトリン、スミスリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリンなど、
- ・選択的摂食遮断薬 (Selective feeding blockers)、例えばフロニカミド、ピメトロジンなど、
- ・スピノシン、例えばスピノサドなど、20  
ならびにそれらの混合物。

#### 【0022】

##### e ) 植物成長調整剤

植物ホルモン (Plant hormone) (植物ホルモン (phytohormone) としても知られる) は、植物成長を調整する化学物質である。植物ホルモンは植物内で産生されるシグナル分子であり、極めて低濃度で生じる。ホルモンは標的細胞にて局所的に細胞プロセスを調整し、他の部位へ移動すると、植物の他の部位にて調整する。植物は、動物と異なり、ホルモンを産生および分泌する腺が欠如している。植物ホルモンは植物を形づくり、種子成長、開花時期、花の性、ならびに葉および果実の老化に影響する。それらは組織の成長の促進および組織の成長の減速、葉形成および茎成長、果実の形成および成熟、植物寿命、さらには植物の死にさえ影響する。ホルモンは植物成長に不可欠であり、それを欠くと、植物は多くの場合、未分化細胞の塊になるであろう。以下に、適当な植物成長調整剤を挙げる：30

- ・アビグリシン、
- ・シアナミド、
- ・ジベレリン、例えばジベレリン酸など、
- ・第四級アンモニウム、例えばクロルメコートクロリド、メピコートクロリドなど、
- ・エチレンジェネレーター、例えばエテホンなど。

#### 【0023】

##### f ) 殺鼠剤

殺鼠剤は、げっ歯類を死滅させることを目的とする有害生物駆除の化学物質のカテゴリーである。げっ歯類は、その食性が彼らのスカベンジャーとしての立場を反映しているため、毒で死滅させることが困難である。彼らは何かのかけらを食べ、待ち、具合が悪くなれば、食べ続けるようである。効果的な殺鼠剤は致死濃度で無味無臭でなければならず、遅延性の効果を有しなければならない。以下に、適当な殺鼠剤の例を挙げる：40

#### 【0024】

抗凝血剤は、慢性型の（致死量の摂取から1～2週間後に死に至り、それより早いのはまれである）、単回投与（第二世代）または複数回投与（第一世代）用の累積性の殺鼠剤として定義される。ブロジファクム、クマテトラリルまたはワルファリンなどの抗凝血剤の致死量によって、致死的な内出血が引き起こされる。有効量にあるこれらの物質は抗ビ50

タミンKであり、酵素K<sub>1</sub>-2,3-エポキシド-レダクターゼ（この酵素は4-ヒドロキシクマリン/4-ヒドロキシチアクマリン誘導体によって優先的に遮断される）およびK<sub>1</sub>-キノン-レダクターゼ（この酵素はインダンジオン誘導体によって優先的に遮断される）を遮断し、生物からその活性ビタミンK<sub>1</sub>源を奪う。これはビタミンKサイクルの破壊をもたらし、必須の血液凝固因子（主として血液凝固因子II（プロトロンビン）、VII（プロコンバーチン）、IX（クリスマス因子）およびX（スチュアート因子））の産生不能をもたらす。この特定の代謝破壊に加えて、中毒量の4-ヒドロキシクマリン/4-ヒドロキシチアクマリンおよびインダンジオン抗凝血剤は、小血管（毛細血管）に損傷をもたらし、それらの透過性を増加させ、びまん性の内出血（ヘモラギアス（haemorrhagias））をもたらす。これらの効果は漸進的であり、それらは数日中に発症し、侵害受容性の知覚（nociceptive perceptions）、例えば痛みまたは苦痛を伴わない。中毒の最終段階では、疲弊したげっ歯類は血液量減少性の循環性ショックまたは重度の貧血に陥り、静かに死に至る。殺鼠性の抗凝血剤は、いずれかの第一世代の薬剤（4-ヒドロキシクマリン型：ワルファリン、クマテトラリル；インダンジオン型：ビンドン、ジファシノン、クロロファシノン）であり、一般的に、致死量を蓄積するためにより高濃度（通常0.005～0.1%）を数日間にわたって継続的に摂取することを必要とし、単回摂取では活性が弱いかまたは不活性であり、かつ、第二世代の薬剤、すなわち4-ヒドロキシクマリンの誘導体（ジフェナコウム、プロジェクトアクム、プロマジオロンおよびフロクマフェン）または4-ヒドロキシ-1-ベンゾチイン-2-オン（4-ヒドロキシ-1-チアクマリン、時に誤って4-ヒドロキシ-1-チオクマリンと呼ばれる、理由についてはヘテロ環化合物を参照のこと）、すなわちジフェチアロンよりも毒性が弱い。第二世代の薬剤は第一世代の薬剤よりもはるかに毒性が強く、一般的に餌中により低濃度で適用され（通常0.001～0.005%のオーダー）、餌の単回摂取で致死的であり、第一世代の抗凝血剤に対して耐性を持つようになったげっ歯類の系統に対しても効果的であり、それゆえ、第二世代の抗凝血剤は時に「スーパーワルファリン」と呼ばれる。時には、抗凝血性殺鼠剤は、抗生物質、最も一般的にはスルファキノキサリンによって増強される。この組み合わせ（例えばワルファリン0.05%+スルファキノキサリン0.02%、またはジフェナコウム0.005%+スルファキノキサリン0.02%など）の目的は、抗生物質/静菌剤がビタミンK源である腸内（intestinal/gut）の共生微生物叢を抑制することである。それゆえ、共生細菌は死滅させられるか、またはそれらの代謝機能が損なわれ、それによるビタミンKの産生が減少するが、これは抗凝血剤の作用に論理的に寄与する効果である。スルファキノキサリン以外の抗生物質、例えばコトリモキサゾール、テトラサイクリン、ネオマイシンまたはメトロニダゾールが用いられてもよい。殺鼠性の餌に用いられるさらなる相乗作用は、抗凝血剤と、ビタミンD活性を有する化合物、すなわちコレカルシフェロールまたはエルゴカルシフェロール（下記参照のこと）の組み合わせの相乗作用である。用いられる典型的な処方は、例えば、ワルファリン0.025～0.05%+コレカルシフェロール0.01%である。いくつかの国では、さらに固定した3成分殺鼠剤、すなわち抗凝血剤+抗生物質+ビタミンD、例えばジフェナコウム0.005%+スルファキノキサリン0.02%+コレカルシフェロール0.01%がある。第二世代の抗凝血剤と抗生物質および/またはビタミンDの組み合わせは、最も耐性が強いげっ歯類の系統に対してさえ効果的であると考えられるが、もっとも、いくつかの第二世代の抗凝血剤（すなわちプロジェクトアクムおよびジフェチアロン）は、餌中の濃度0.0025～0.005%でさえ非常に毒性が強いため、耐性を有する既知のげっ歯類の系統は存在せず、他の誘導体に対して耐性を有するげっ歯類でさえ、これらの最も毒性が強い抗凝血剤の適用によって確実に駆除される。

#### 【0025】

ビタミンK<sub>1</sub>は、誤って、または意図的に（ペットに対する毒攻撃、自殺未遂）抗凝血性の毒に曝露されたペットまたはヒト用の解毒剤として提案され、うまく用いられている。さらに、これらの毒のいくつかは肝機能を阻害することによって作用し、中毒の進行段階では、いくつかの血液凝固因子および循環血液の全容量が欠乏しているため、輸血（任

10

20

30

40

50

意に凝固因子が存在している)は不注意にそれらを摂取した人の生命を救いうるが、これはいくつかのより古い毒に対して有効である。

#### 【0026】

金属リン化物はげっ歯類を死滅させる手段として用いられており、単回投与用の即効性の殺鼠剤(通常は単回の餌摂取から1~3日以内に死に至る)であると考えられている。食物およびリン化物(通常はリン化亜鉛)からなる餌を、げっ歯類が食べることができるような場所に放置する。げっ歯類の消化器系中の酸がリン化物と反応し、有毒なホスフィンガスが生じる。この害虫駆除方法は、げっ歯類が抗凝血剤のいくつかに対して耐性を有している場合に使用することができ、特にハツカネズミおよび野ネズミの駆除に使用できる; リン化亜鉛入りの餌もほとんどの第二世代の抗凝血剤より安価であり、それゆえ時には、げっ歯類が大量に侵入した場合、多量のリン化亜鉛入りの餌を適用することによって彼らの集団は最初に減少し、次いで最初の即効性の毒を切り抜けて生き残った集団の残りは抗凝血剤入りの餌の長期の摂取によって根絶される。逆に、抗凝血剤入りの毒餌を切り抜けて生き残った個々のげっ歯類(残りの集団)は、1または2週間、前もって彼らに無毒性の餌を与え(pre-baiting)(これは餌嫌いを克服し、特定の食物を提供することによって特定の場所で摂食することにげっ歯類を慣れさせるために重要であり、特にラットを根絶する際に重要である)、次いで、餌の全ての消費が終わるまで(通常2~4日以内)、前もって与えた餌(pre-baiting)に用いられたものと同じ種類の毒餌を適用することによって根絶することができる。異なる作用様式を有する殺鼠剤を次々に用いるこれらの方法は、餌の許容性/嗜好性が良好であれば(すなわち、げっ歯類が容易にそれを餌にすれば)、その場所のげっ歯類集団の事実上またはほぼ100%の根絶を提供する。

10

20

30

40

50

#### 【0027】

リン化物はかなり即効性の殺鼠剤であり、その結果、ラットは通常、彼らがはびこっているビルではなく空地で死ぬ。典型例は、リン化アルミニウム(燻蒸剤のみ)、リン化カルシウム(燻蒸剤のみ)、リン化マグネシウム(燻蒸剤のみ)およびリン化亜鉛(餌中)である。リン化亜鉛は典型的には、げっ歯類の餌に約0.75~2%の量にて加えられる。該餌は、加水分解によって遊離したホスフィンに特徴的な強い、刺激性のニンニク様の匂いを有する。匂いはげっ歯類を引き付ける(または、少なくとも、不快にさせない)が、他の哺乳類を不快にさせる効果を有する。しかしながら、鳥類(特に野生の七面鳥)は匂いに敏感ではなく、該餌を摂食し、それゆえ巻き添え被害を被る。

#### 【0028】

##### 高カルシウム血症

カルシフェロール(ビタミンD)、コレカルシフェロール(ビタミンD<sub>3</sub>)およびエルゴカルシフェロール(ビタミンD<sub>2</sub>)は殺鼠剤として用いられるが、これらは哺乳類にとって有益であるのと同じ理由でげっ歯類に対して毒性がある: それらは体内のカルシウムおよびリン酸エステルの恒常性に影響する。ビタミンDの必要量は少量であり(1日当たり体重1キログラムにつき数IUであり、これは1ミリグラムのほんの何分の1かにすぎない)、ほとんどの脂溶性ビタミンと同様に、それらは容易にいわゆるビタミン過剰症、すなわち、簡単に言うと、ビタミンによる中毒をもたらすため、大用量で毒性となる。中毒が非常に重篤である場合(すなわち、毒物の用量が十分に高い場合)、それは最終的に死をもたらす。殺鼠性の餌を消費するげっ歯類において、カルシウムレベルを上昇させることによって高カルシウム血症がもたらされるが、主として食物からのカルシウム吸収を増加させ、骨基質に固定したカルシウムをイオン化形態(主として部分的に血漿タンパク質に結合した炭酸一水素カルシウムカチオン、[CaHCO<sub>3</sub>]<sup>+</sup>)に動員し、血漿中に溶解して循環し、致死量の摂取後、遊離カルシウムレベルが十分に上昇し、それによって血管、腎臓、胃壁および肺が石灰化/カルシウム沈着し(組織内でカルシウム沈着、カルシウム塩/錯体の結晶が形成し、それゆえ組織に損傷を与える)、さらに心臓障害をもたらし(心筋は、心筋収縮性および心房と心室の間の興奮の伝播の両方に影響する遊離カルシウムレベルの変動に敏感である)、出血し(毛細血管損傷のため)、腎不全をもたらす可能性もある。単回投与、または累積投与(用いられる濃度に依存する; 通常の0.07

5 % の餌濃度は、餌の大部分の単回摂取の後、ほとんどのげっ歯類に致死的である）、亜慢性投与（通常、餌の摂取後、数日から 1 週間以内で死に至る）が考えられる。単独で用いられる場合、適用される濃度は 0.075 % コレカルシフェロールおよび 0.1 % エルゴカルシフェロールである。抗凝血性の毒物と相乗的であるというカルシフェロール毒物学の重要な特徴がある。これは、同一餌中の抗凝血剤およびカルシフェロールの混合物は、餌中の抗凝血剤およびカルシフェロールの毒性の合計よりも毒性が強いため、大幅に低い餌中のカルシフェロール含量によって強力な高カルシウム血症の効果を達成することができるこ<sup>10</sup>とを意味し、その逆もまた同じである。カルシフェロールが存在する場合、より顕著な抗凝血性 / 出血性効果が観察される。カルシフェロールの効果的な濃度は、ほとんどの抗凝血剤の効果的な濃度よりも高価であるため、この相乗作用は、ほとんどは低カルシフェロールの餌中で用いられる。殺鼠性の餌におけるカルシフェロールの歴史的に最初の適用は、実際、1970 年代前半にさかのぼり、ワルファリン 0.025 % + エルゴカルシフェロール 0.1 % を含有する Sorex 社製品の Sorexa (登録商標) D (今日の Sorexa (登録商標) D と異なる処方を有する) であった。今日、Sorexa (登録商標) CD は、0.0025 % ジフェナコウム + 0.075 % コレカルシフェロールの組み合わせを含有する。カルシフェロール 0.075 ~ 0.1 % (例えば 0.075 % コレカルシフェロールを含有する Quintox (登録商標) ) を単独で、またはカルシフェロール 0.01 ~ 0.075 % と抗凝血剤の組み合わせを含有する多数の他のブランド製品が市販されている。

## 【0029】

## g ) 殺ダニ剤、軟体動物駆除剤および殺線虫剤

殺ダニ剤は、ダニを死滅させる駆除剤である。抗生素系殺ダニ剤、カルバメート系殺ダニ剤、ホルムアミジン系殺ダニ剤、ダニ増殖調整剤、有機塩素、ペルメトリンおよび有機リン酸エステル系殺ダニ剤は、全てこのカテゴリーに属する。軟体動物駆除剤は、軟体動物、例えば蛾、ナメクジおよびカタツムリなどを制御するために用いられる駆除剤である。これらの物質は、メタアルデヒド、メチオカルブおよび硫酸アルミニウムを含む。殺線虫剤は、寄生線虫（虫の門の一つ）を死滅させるために用いられる化学駆除剤の 1 種である。殺線虫剤は、ニームの木のシードケーキから得られ、これは、油抽出後のニームシードの残渣である。ニームの木は、世界中でいくつかの名前で知られているが、最初に栽培されたのはインドであり、古代から栽培されている。

## 【0030】

## h ) 抗菌剤

下記の例に、本発明の農薬組成物に適切な抗菌剤を与える。主に用いられる殺菌性の消毒剤 (disinfectants) は、下記を用いる：

- ・活性塩素（すなわち、次亜塩素酸塩、クロラミン、ジクロロイソシアヌレートおよびトリクロロイソシアヌレート、湿塩素、二酸化塩素など）、
- ・活性酸素（過酸化物、例えば過酢酸、過硫酸カリウム、過ホウ酸ナトリウム、過炭酸ナトリウムおよび尿素過水和物など）、
- ・ヨウ素（ヨードポビドン（ポビドン - ヨウ素、ベタジン）、ルゴール液、ヨードチンキ、ヨウ素化非イオン性界面活性剤）、
- ・濃縮アルコール（主としてエタノール、n - プロパノールとも呼ばれる 1 - プロパノール、およびイソプロパノールとも呼ばれる 2 - プロパノール、ならびにその混合物；さらに、2 - フェノキシエタノールならびに 1 - および 2 - フェノキシプロパノールが用いられる）、
- ・フェノール性物質（例えばフェノール（「石炭酸」とも呼ばれる）、クレゾール（液体カリウム石けんと組み合わせて「ライソール (Lysole)」と呼ばれる）、ハロゲン化（塩素化、臭素化）フェノール、例えばヘキサクロロフェン、トリクロサン、トリクロロフェノール、トリブロモフェノール、ペンタクロロフェノール、ジブロモール (Dibromol) およびその塩など）、
- ・カチオン性界面活性剤、例えばいくつかの第四級アンモニウムカチオン（例えば、塩化ベンザルコニウム、臭化または塩化セチルトリメチルアンモニウム、塩化ジデシルジメチ

10

20

30

40

50

ルアンモニウム、塩化セチルピリジニウム、塩化ベンゼトニウム)など、第四級以外の化合物、例えばクロルヘキシジン、グルコプロタミン、二塩酸オクテニジンなど)、

- ・強酸化剤、例えばオゾンおよび過マンガン酸塩溶液など;
- ・重金属およびそれらの塩、例えばコロイド銀、硝酸銀、塩化水銀、フェニル水銀塩、硫酸銅、酸化銅クロライドなど。重金属およびそれらの塩は、最も毒性が強く、環境的に危険な殺菌剤であり、それゆえ、それらの使用は強く抑制または禁止されている;さらに、
- ・適切に濃縮された強酸(リン酸、硝酸、硫酸、アミド硫酸、トルエンスルホン酸)および
- ・アルカリ(水酸化ナトリウム、カリウム、カルシウム)はpH < 1または> 13の間で、特に高温(60以上)以下で細菌を死滅させる。

10

#### 【0031】

消毒剤(antiseptics)(すなわち、ヒトまたは動物の体、皮膚、粘膜、傷などに用いることができる殺菌剤)として、上記の消毒剤(disinfectants)のうち、適切な条件下(主として濃度、pH、温度およびヒト/動物に対する毒性)で用いることができるものはほとんどない。それらの中で重要なものは以下である:

- ・いくつかの適切に希釈した塩素製剤(例えばデーキン液、0.5%次亜塩素酸ナトリウムまたはカリウム溶液、pH 7~8に調整した、または0.5~1%のベンゼンスルホンクロルアミドナトリウム(クロラミンB)の溶液)、
- ・いくつかのヨウ素製剤、例えば様々なガレヌス(galenics)(軟膏剤、液剤、絆創膏)中のヨードボビドン、過去にはさらにルゴール液など、
- ・過酸化物、例えば尿素過水和物溶液およびpH緩衝0.1~0.25%過酢酸溶液、
- ・主として皮膚消毒に用いられる、消毒添加剤を含むまたは含まないアルコール、
- ・弱有機酸、例えばソルビン酸、安息香酸、乳酸およびサリチル酸など、
- ・いくつかのフェノール性化合物、例えばヘキサクロロフェン、トリクロサンおよびジブロモール(Dibromol)など、ならびに
- ・カチオン活性化合物、例えば0.05~0.5%ベンザルコニウム、0.5~4%クロルヘキシジン、0.1~2%オクテニジン溶液など。

20

#### 【0032】

殺菌性抗生物質は、細菌を死滅させ、静菌性抗生物質は、それらの増殖または繁殖を遅延させるだけである。ペニシリンは、セファロスポリンのような殺菌剤である。アミノグリコシド系抗生物質は、殺菌的様式(細胞壁前駆体を破壊することによって溶菌をもたらす)および静菌的様式(30sリボソームサブユニットに結合し、翻訳の忠実性を減少させることによって不正確なタンパク質合成をもたらす)の両方で作用することができる。本発明に用いられる他の殺菌性抗生物質は、フルオロキノロン、ニトロフラン、バンコマイシン、モノバクタム、コトリモキサゾール、およびメトロニダゾールを含む。好ましい活性剤は浸透性または部分的浸透性の作用様式を有するものであり、例えばアゾキシストロピンなどである。

30

#### 【0033】

バイオサイドは、次の群のいずれかから選択することが、全般的に好ましい:

- (i) アゾール、ストロビルリン、ジフェニルエーテル、アニリド、有機ホスフェート、合成ピレトイド、ネオニコチノイド、オキサジアジン、ベンゾイル尿素、フェニルカルバメート、クロロアセトアミド、トリケトン、ピリジンカルボン酸、シクロヘキサンジオノキシム、フェニルピラゾール、グリホサートおよびその塩、ならびにそれらの混合物からなる群、または
- (ii) オキシフルロフェン(oxyflurofen)、プロパニル、クロルピリホス、ビフェントリン、デルタメトリン、アゾキシストロピン、クレソキシム(krexoxim)-メチル、ラムダ-シハロトリル、ノバルロン、ルフェヌロン、イミダクロブリド、チアクロブリド、インドキサカルブ、オキシフルオルフェン、フルロキシピルおよびそのエステル、フェンメジファム、デスマジファム、アセトクロル、テブコナゾール、エポキシコナゾール、プロピコナゾール、フェンブコナゾール、トリアジメノール、フィプロニル、ならびにそれら

40

50

の混合物からなる群。

【0034】

〔油成分または共溶媒〕

適当な油成分または共溶媒(成分c)は、例えば6～18個、好ましくは8～10個の炭素原子を有する脂肪アルコールに基づくゲルベアルコール、直鎖状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>脂肪酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-脂肪アルコールとのエステルまたは分岐状C<sub>6</sub>～C<sub>13</sub>カルボン酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>脂肪アルコールとのエステル、例えばミリスチン酸ミリスチル、パルミチン酸ミリスチル、ステアリン酸ミリスチル、イソステアリン酸ミリスチル、オレイン酸ミリスチル、ベヘン酸ミリスチル、エルカ酸ミリスチル、ミリスチン酸セチル、パルミチン酸セチル、ステアリン酸セチル、イソステアリン酸セチル、オレイン酸セチル、ベヘン酸セチル、エルカ酸セチル、ミリスチン酸ステアリル、パルミチン酸ステアリル、ステアリン酸ステアリル、イソステアリン酸ステアリル、オレイン酸ステアリル、ベヘン酸ステアリル、エルカ酸ステアリル、ミリスチン酸イソステアリル、パルミチン酸イソステアリル、ステアリン酸イソステアリル、イソステアリン酸イソステアリル、オレイン酸イソステアリル、ベヘン酸イソステアリル、オレイン酸イソステアリル、ミリスチン酸オレイル、パルミチン酸オレイル、ステアリン酸オレイル、イソステアリン酸オレイル、オレイン酸オレイル、ベヘン酸オレイル、エルカオレイル酸、ミリスチン酸ベヘニル、パルミチン酸ベヘニル、ステアリン酸ベヘニル、イソステアリン酸ベヘニル、オレイン酸ベヘニル、ベヘン酸ベヘニル、エルカ酸ベヘニル、ミリスチン酸エルシル、パルミチン酸エルシル、ステアリン酸エルシル、イソステアリン酸エルシル、オレイン酸エルシル、ベヘン酸エルシルおよびエルカ酸エルシルなどである。直鎖状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-脂肪酸と分枝状アルコール(特に2-エチルヘキサノール)とのエステル、C<sub>18</sub>～C<sub>38</sub>-アルキルヒドロキシカルボン酸と直鎖状または分枝状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-脂肪アルコール(特に、ジオクチルマレート)とのエステル、直鎖状および/または分枝状脂肪酸と多価アルコール(例えばプロピレンギリコール、ダイマージオールまたはトリマートリオール)および/またはゲルベアルコールとのエステル、C<sub>6</sub>～C<sub>10</sub>-脂肪酸に基づくトリグリセリド、C<sub>6</sub>～C<sub>18</sub>-脂肪酸に基づく液体のモノ-/ジ-/トリグリセリド混合物、C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-脂肪アルコールおよび/またはゲルベアルコールと芳香族カルボン酸との、特に安息香酸とのエステル、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>-ジカルボン酸と1～22個の炭素原子を有する直鎖状または分枝状アルコール(Cetiol(登録商標)B)または2～10個の炭素原子および2～6個のヒドロキシル基を有するポリオールとのエステル、植物油、分枝状第一級アルコール、置換シクロヘキサン、直鎖状および分枝状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-脂肪アルコールカーボネート、例えば、炭酸ジカブリリル(Cetiol(登録商標)CC)、6～18個、好ましくは8～10個の炭素原子を有する脂肪アルコールに基づくゲルベカーボネート、安息香酸と直鎖状および/または分枝状C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>-アルコール(例えばCetiol(登録商標)AB)とのエステル、アルキル基1つあたりに6～22個の炭素原子を有する、直鎖状または分枝状、対称または非対称ジアルキルエーテル、例えばジカブリリルエーテル(Cetiol(登録商標)OE)、エポキシ化脂肪酸エステルのポリオールによる開環生成物、シリコーン油(シクロメチコーン、シリコンメチコーングレード等)、脂肪族またはナフテン系炭化水素、例えばスクアラン、スクアレンまたはジアルキルシクロヘキサンおよび/または鉱物油である。

【0035】

好ましい油成分または共溶媒はエステル構造を示す。アジピン酸エステル(Cetiol(登録商標)B、Agnique(登録商標)DiME 6)、乳酸エステル、植物油のメチルエステル(Agnique ME 18RD-F、Agnique(登録商標)ME 12C-F)、アルキルエステル(Agnique(登録商標)Ae 3-2EH=2-エチルヘキシルラクテート)(全ての製品はCognis GmbH(デュッセルドルフ)より市販されている)が特に好ましい。

【0036】

〔乳化剤〕

適当な乳化剤(成分d)としては、非イオン性界面活性剤およびアニオン性界面活性剤

10

20

30

40

50

およびそれらの混合物が挙げられる。非イオン性界面活性剤としては、例えば以下が挙げられる：

- ・直鎖状 C<sub>8-22</sub> 脂肪アルコールへの、C<sub>12-22</sub> 脂肪酸への、および、アルキル基において 8 ~ 15 個の炭素原子を含有するアルキルフェノールへの、エチレンオキシド 2 ~ 30 モルおよび / またはプロピレンオキシド 0 ~ 5 モルの付加生成物、
- ・グリセロールへのエチレンオキシド 1 ~ 30 モル付加生成物の C<sub>12/18</sub> 脂肪酸モノエステルおよびジエステル、
- ・6 ~ 22 個の炭素原子を含有する飽和および不飽和脂肪酸のグリセロールモノエステルおよびジエステルならびにソルビタンモノエステルおよびジエステル、ならびに、それらのエチレンオキシド付加生成物、
- ・ヒマシ油および / または水素添加ヒマシ油へのエチレンオキシド 15 ~ 60 モルの付加生成物、
- ・ポリオールエステル、および、特にポリグリセロールエステル、例えばポリグリセロールポリリシノレート、ポリグリセロールポリ-1,2-ヒドロキシステアレートまたはポリグリセロールダイメレート (dimerate) イソステアレート、これらの種類の複数の化合物の混合物も適当である、
- ・ヒマシ油および / または水素化ヒマシ油へのエチレンオキシド 2 ~ 15 モルの付加生成物、
- ・直鎖状、分枝状、不飽和または飽和の C<sub>6-22</sub> 脂肪酸、リシノール酸および 1,2-ヒドロキシステアリン酸、および、グリセロール、ポリグリセロール、ペンタエリスリトール、-ジペンタエリスリトール、糖アルコール（例えばソルビトール）、アルキルグルコシド（例えばメチルグルコシド、ブチルグルコシド、ラウリルグルコシド）およびポリグルコシド（例えばセルロース）に基づく、部分エステル、
- ・モノアルキルホスフェート、ジアルキルホスフェート、トリアルキルアルキルホスフェート、モノ-P E G-アルキルホスフェート、ジ-P E G-アルキルホスフェートおよび / またはトリ-P E G-アルキルホスフェートならびにそれらの塩、
- ・羊毛脂アルコール、
- ・ポリシロキサン / ポリアルキルポリエーテルコポリマーおよび対応する誘導体、
- ・ペンタエリスリトール、脂肪酸、クエン酸および脂肪アルコールの混合エステルおよび / または C<sub>6-22</sub> 脂肪酸、メチルグルコースおよびポリオール、好ましくはグリセロールまたはポリグリセロールの混合エステル、
- ・ポリアルキレングリコール、および、

### 【0037】

脂肪アルコール、脂肪酸、アルキルフェノール、脂肪酸のグリセロールモノエステル、脂肪酸のグリセロールジエステル、脂肪酸のソルビタンモノエステル、脂肪酸のソルビタンジエステルへの、または、ヒマシ油への、エチレンオキシドおよび / またはプロピレンオキシド付加生成物は、既知の市販生成物である。これらは同族体混合物であり、その平均アルコキシ化度は、エチレンオキシドおよび / またはプロピレンオキシドと付加反応を行う基質との、物質量の比に相当する。グリセロールへのエチレンオキシド付加生成物の C<sub>12/18</sub>-脂肪酸モノエステルおよびジエステルは、化粧品製剤のための脂質層エンハンサーとして知られている。好ましい乳化剤を、より詳細に以下に説明する。

### 【0038】

#### a ) 部分グリセリド

適当な部分グリセリドの通常の例は、ヒドロキシステアリン酸モノグリセリド、ヒドロキシステアリン酸ジグリセリド、イソステアリン酸モノグリセリド、イソステアリン酸ジグリセリド、オレイン酸モノグリセリド、オレイン酸ジグリセリド、リシノール酸モノグリセリド、リシノール酸ジグリセリド、リノレイン酸モノグリセリド、リノレイン酸ジグリセリド、リノレン酸モノグリセリド、リノレン酸ジグリセリド、エルカ酸モノグリセリド、エルカ酸ジグリセリド、酒石酸モノグリセリド、酒石酸ジグリセリド、クエン酸モノグリセリド、クエン酸ジグリセリド、リンゴ酸モノグリセリド、リンゴ酸ジグリセリドな

10

20

30

40

50

らびに製造工程由來の少量のトリグリセリドを含み得るそれらの工業用混合物である。前記部分グリセリドへの 1 ~ 3 0 m o l、好ましくは 5 ~ 1 0 m o l のエチレンオキシドの付加生成物も、同様に適する。

【 0 0 3 9 】

b ) ソルビタンエステル

適當なソルビタンエステルは、ソルビタンモノイソステアレート、ソルビタンセスキイソステアレート、ソルビタンジイソステアレート、ソルビタントリイソステアレート、ソルビタンモノオレエート、ソルビタンセスキオレエート、ソルビタンジオレエート、ソルビタントリオレエート、ソルビタンモノエルケート、ソルビタンセスキエルケート、ソルビタンジエルケート、ソルビタントリエルケート、ソルビタンモノリシノレエート、ソルビタンセスキリシノレエート、ソルビタンジリシノレエート、ソルビタントリリシノレエート、ソルビタンモノヒドロキシステアレート、ソルビタンセスキヒドロキシステアレート、ソルビタンジヒドロキシステアレート、ソルビタントリヒドロキシステアレート、ソルビタンモノタルトレート、ソルビタンセスキタルトレート、ソルビタンジタルトレート、ソルビタントリタルトレート、ソルビタンモノシトレート、ソルビタンセスキシトレート、ソルビタンジシトレート、ソルビタントリシトレート、ソルビタンモノマレエート、ソルビタンセスキマレエート、ソルビタンジマレエート、ソルビタントリマレエートおよびこれらの工業用混合物である。前記ソルビタンエステルの、エチレンオキシドの 1 ~ 3 0 m o l、好ましくは 5 ~ 1 0 m o l 付加生成物も、同様に適する。

10

20

30

40

50

【 0 0 4 0 】

c ) アルキル (アルケニル) オリゴグリコシド

好ましい乳化剤でもあるアルキルまたはアルケニルオリゴグリコシドは、5 または 6 個の炭素原子を含有するアルドースまたはケトース、好ましくはグルコースから誘導させてよい。したがって、好ましいアルキルおよび / またはアルケニルオリゴグリコシドは、アルキルまたはアルケニルオリゴグルコシドである。これらの物質は、一般的に、「アルキルポリグリコシド」(A P G) として既知である。本発明のアルキル (アルケニル) オリゴグリコシドは、式 (IV) :

【 0 0 4 1 】

【 化 2 】



[ 式中、 R<sup>4</sup> は、 6 ~ 2 2 個の炭素原子を有するアルキルまたはアルケニル基であり、 G は 5 または 6 個の炭素原子を有する糖単位であり、 p は 1 ~ 1 0 の数である ]

に相当する。一般式 (II) における添え字 p は、オリゴマー化度 (D P 度)、すなわちモノグリコシドおよびオリゴグリコシドの分布を示し、1 ~ 1 0 の数である。特定の化合物において p は常に整数でなければならず、とりわけ 1 ~ 6 の値をとり得るが、いくつかのアルキルオリゴグリコシドについての値 p は、分析的に測定された計算された量であり、たいてい分数である。1.1 ~ 3.0 の平均オリゴマー化度 p を有するアルキル (アルケニル) オリゴグリコシドが好ましく使用される。1.7 未満、より具体的には 1.2 ~ 1.4 のオリゴマー化度を有するアルキル (アルケニル) オリゴグリコシドは、応用的観点から好ましい。アルキル基またはアルケニル基 R<sup>5</sup> は、4 ~ 2 2 個、好ましくは 8 ~ 1 6 個の炭素原子を含有する第一級アルコールから誘導してよい。その例は、ブタノール、カプロン酸アルコール、カブリル酸アルコール、カブリン酸アルコール、ウンデシルアルコール、ラウリルアルコール、ミリストルアルコール、セチルアルコール、パルミトレイルアルコール、ステアリルアルコール、イソステアリルアルコール、オレイルアルコール、エライジルアルコール、ペトロセリニルアルコール、アラキルアルコール、ガドレイルアルコール、ベヘニルアルコール、エルシルアルコールおよび例えば工業用脂肪酸メチルエステルの水素添加においてまたはローレンオキソ合成からのアルデヒドの水素添加においての過程において形成されるようなそれらの工業用混合物である。1 ~ 3 の D P を有する水素化 C<sub>8</sub> - C<sub>16</sub> ココナツ油アルコールに基づくアルキルオリゴグルコシドが好ましい。ア

ルキルオリゴグルコシドのアルコキシ化生成物、例えば1.2～1.4のDPを有するC<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>またはC<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>アルキルオリゴグルコシドへのエチレンオキシド1～10モルおよび/またはプロピレンオキシド1～5モルの付加物も適当である。

#### 【0042】

##### d) アルコキシ化植物油

適当な乳化剤は、エチレンオキシド3～80でエトキシ化されたヒマシ油、菜種油、大豆油(Agnique(登録商標)CSO 35、Agnique(登録商標)SBO 10、Agnique(登録商標)SBO 60)である。

#### 【0043】

##### e) アルコキシ化コポリマー

通常のコポリマーは、C<sub>2</sub>-C<sub>22</sub>直鎖状または分枝状アルコールのエトキシ化およびプロポキシ化ブロックポリマーおよび/または、エトキシ化およびプロポキシ化ランダムポリマーである。

#### 【0044】

##### f) アニオン性乳化剤

通常のアニオン性乳化剤は、アルキルベンゼンスルホン酸およびそれらの塩、例えばイソブタノールに溶解させたドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム(Agnique(登録商標)ABS 65C)または2-エチルヘキサノールに溶解させたドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム(Agnique(登録商標)ABS 60C-EH)など、ジアルキルスルホサクシネート、例えばジ-2-エチルヘキシルスルホサクシネートまたはジオクチルスルホサクシネート、および1,000～50,000の分子量を有するポリアクリレートを包含する。

#### 【0045】

##### g) 種々の乳化剤

他の適当な乳化剤は、双性イオン性界面活性剤である。双性イオン性界面活性剤は、分子中に少なくとも1個の第四級アンモニウム基および少なくとも1個のカルボキシレートおよび1個のスルホネート基を含有する表面活性化合物である。特に適当な双性イオン性界面活性剤は、いわゆるベタイン、例えばN-アルキル-N,N-ジメチルアンモニウムグリシネート、例えばココアルキルジメチルアンモニウムグリシネート、N-アシルアミノプロピル-N,N-ジメチルアンモニウムグリシネート、例えばアルキル基またはアシル基において8～18個の炭素原子を含有する、ココアシルアミノプロピルジメチルアンモニウムグリシネートおよび2-アルキル-3-カルボキシメチル-3-ヒドロキシエチルイミダゾリンならびにココアシルアミノエチルヒドロキシエチルカルボキシメチルグリシネートである。コカミドプロピルベタインのCTFA名で知られる脂肪酸アミド誘導体が特に好ましい。両性界面活性剤も適当な乳化剤である。両性界面活性剤は、分子内に、C<sub>8/18</sub>アルキル基またはアシル基に加えて、少なくとも1個の遊離のアミノ基および少なくとも1個の-COOH基または-SO<sub>3</sub>H基を含有し、内部塩を形成することができる、表面活性化合物である。適当な両性界面活性剤の例は、アルキル基において約8～18個の炭素原子を含有する、N-アルキルグリシン、N-アルキルプロピオン酸、N-アルキルアミノ酪酸、N-アルキルイミノジプロピオン酸、N-ヒドロキシエチル-N-アルキルアミドプロピルグリシン、N-アルキルタウリン、N-アルキルサルコシン、2-アルキル-アミノブリピオニ酸およびアルキルアミノ酢酸である。特に好ましい両性界面活性剤は、N-ココアルキルアミノプロピオネート、ココアシルアミノエチルアミノプロピオネートおよびC<sub>12/18</sub>アシルサルコシンである。

#### 【0046】

##### (バイオサイド組成物)

バイオサイドの性質に応じて、生成物は以下の組成を示してよい：

任意に水と共に、数値が合計して100重量%となるという条件で、

(a) アルコキシ化オリゴグリセロールエステル、約0.1重量%～約99重量%、好ましくは約15重量%～約70重量%、最も好ましくは約20重量%～約45重量%、

(b) バイオサイド、約1重量%～約99.1重量%、好ましくは約5重量%～約75重

10

20

30

40

50

量%、最も好ましくは約15重量%～約40重量%、

(c)油成分または共溶媒、0～約50重量%、好ましくは約5重量%～約30重量%、より好ましくは約10重量%～約25重量%、および

(d)乳化剤、0～約15重量%、好ましくは約5重量%～約10重量%。

組成物は水で希釈される濃縮物を表し、最終消費者に濃縮物によって示される約0.5～約5、好ましくは約0.5～約1%の活性物質を含有する水性製剤を与える。

#### 【0047】

##### 産業上の利用

本発明の別の態様は、アルコキシ化オリゴグリセロールエステルのバイオサイド用補助剤としての使用に関する。通常、該エステルは、タンク混合または缶製剤において、バイオサイド(好ましくは殺菌剤)と併用して、約20～約2,000、好ましくは約40～約500g/ha補助剤の投与率で使用される。以下の温室実験例に示されるように、最適化された生成物は約50%コントロール～95%超コントロールまでの亜致死量で、標準のバイオサイド製剤を強化することができる。10

#### 【実施例】

##### 【0048】

##### 〔実施例1〕

###### ジグリセロール高オレイン酸ヒマワリ脂肪酸モノエステルの合成

1モルの工業統計的なジグリセロール+10EO、1モルのHO-SO-ME(高オレイン酸ヒマワリ脂肪酸メチルエステル)、および55gの亜リン酸カリウム(メタノール中25重量%)をフラスコに入れた。この混合物を攪拌しながら徐々に220まで加熱した。約160～180の温度で反応が勢いよく開始した。メタノールの第1の主要分を除去した後、真空を1ミリバール未満まで徐々に下げ、反応混合物をこれらの条件下でさらに3～4時間維持した。反応が完了すると、さらなる精製を行うことなく生成物を冷却した。870gのジグリセロールヒマワリ脂肪酸モノエステルが、透明の黄色液体として得られた。20

##### 【0049】

##### 〔実施例2〕

###### ジグリセロールオレイン酸ジエステルの合成

130gのジグリセロール+10EO、120gの工業用オレイン酸(Edenor(登録商標)Ti05、Emery Oleochemicals)、および1.7gの次亜リン酸をフラスコに入れ、よく攪拌しながら240まで加熱した。フラスコを窒素雰囲気下に設定した。水を除去した後、さらなる精製を行うことなくエステルを冷却した。240gのジグリセロールオレイン酸ジエステルが、透明の黄色がかかった液体が得られた。30

##### 【0050】

##### 〔実施例3および4〕

次の表1および2に、本発明のアルコキシ化オリゴグリセロールエステルを含む貯蔵安定な製剤を提供する。表1に示す組成物は、一般的な方法で湿式粉碎されており、10μm未満の粒径(D95)を示した。組成物2を安定な製剤が得られるまで攪拌した。

##### 【0051】

10

20

30

40

## 【表1】

アゾキシストロビンの貯蔵安定なSC製剤

量 [g]	製品	化学名
250		アゾキシストロビン
100		グリセロール
150		実施例2のジグリセロールエステル
20	Hydropalat(登録商標)5040	
100	Sovermol(登録商標)820	
380		水

10

## 【0052】

## 【表2】

クロルピリホスのEC-製剤

20

量 [g]	製品	化学名
46		クロルピリホス
20	Agnique(登録商標)AMD 810	
10	Agnique(登録商標)ME 890	
8	Agnique(登録商標)ABS 70C	
16		実施例2のジグリセロールエステル

30

## 【0053】

## 〔実施例5～14〕

## 温室試験

異なるアルコキシ化ジグリセロールエステルおよび非アルコキシ化ジグリセロールエステルの補助特性を、2種の市販されているバイオサイド組成物 Amistar(登録商標) SC 250 (Syngenta、アクティブ：ストロビルリン) および Opus(登録商標) SC 125 (BASF、アクティブ：エポキシコナゾール)と組み合わせて、温室試験において試験した。補助剤は、タンク混合補助剤として、5重量%の量でバイオサイドに添加した。試験方法としては、病原性種としてうどん粉病菌を用いるBarley Segment テストを使用した。表3および表4に結果を示す。実験例5～14は本発明の実施例であり、実験例C1～C10は比較例である。

## 【0054】

## 【表3】

ストロビルリンの補助効果

実験例	バイオサイド+補助剤	うどん粉病感染 (%)
	Amistar(登録商標) (単独)	5 9
5	+ジグリセロール+10EO オレイルテトラエステル	9
6	+ジグリセロール+10EO オレイルジエステル	2
7	+ジグリセロール+10EO オレイルモノエステル	4
8	+ジグリセロール+10EO 亜麻仁モノエステル	9
9	+ジグリセロール+10EO ヒマワリモノエステル	1 2
C 1	+ジグリセロール オレイルテトラエステル	2 9
C 2	+ジグリセロール オレイルジエステル	2 5
C 3	+ジグリセロール オレイルモノエステル	2 1
C 4	+ジグリセロール 亜麻仁モノエステル	2 5
C 5	+ジグリセロール ヒマワリモノエステル	3 1

10

## 【0055】

【表4】

エポキシコナゾールの補助効果

20

実験例	バイオサイド+補助剤	うどん粉病感染 (%)
	Opus(登録商標) (単独)	3 6
10	+ジグリセロール+10EO オレイルテトラエステル	1 9
11	+ジグリセロール+10EO オレイルジエステル	1 4
12	+ジグリセロール+10EO オレイルモノエステル	1 9
13	+ジグリセロール+10EO 亜麻仁モノエステル	1 9
14	+ジグリセロール+10EO ヒマワリモノエステル	1 1
C 6	+ジグリセロール オレイルテトラエステル	2 8
C 7	+ジグリセロール オレイルジエステル	2 5
C 8	+ジグリセロール オレイルモノエステル	2 5
C 9	+ジグリセロール 亜麻仁モノエステル	2 4
C 10	+ジグリセロール ヒマワリモノエステル	2 4

30

## 【0056】

全ての補助剤が、ストロビルリンおよびエポキシコナゾールの両方を強化することがわかった。しかしながら、2個のオレイル基を含むジグリセロールエステルで極めて優れた結果が得られた。本発明のアルコキシ化エステルは、現在技術から既知の非アルコキシ化種よりも、優れた性能を示すことも示された。

40

## 【国際調査報告】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2011/001579
---

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
INV. A01N25/30 A01N43/54 A01N43/653 A01N57/16		
ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
<b>Category*</b>	<b>Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</b>	<b>Relevant to claim No.</b>
X	EP 0 539 980 A1 (KAO CORP [JP]) 5 May 1993 (1993-05-05) cited in the application page 7, line 49 - page 8, line 54 claims 1-20 -----	1-14
A	WO 2004/073404 A1 (CLARIANT GMBH [DE]; ZERRER RALF [DE]; SCHERL FRANZ-XAVER [DE]) 2 September 2004 (2004-09-02) the whole document -----	1-14
A	WO 01/08481 A1 (CLARIANT GMBH [DE]) 8 February 2001 (2001-02-08) the whole document ----- -/-	1-14
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
<p>* Special categories of cited documents :</p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>"X" document of particular relevance; the claimed invention can not be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>"Y" document of particular relevance; the claimed invention can not be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>"&amp;" document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report	
13 May 2011	23/05/2011	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Kamdzhilov, Yavor	

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No
PCT/EP2011/001579

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 03/003830 A1 (COGNIS DEUTSCHLAND GMBH [DE]; MAINX HANS-GEORG [DE]; WOLLENWEBER HORST) 16 January 2003 (2003-01-16) the whole document ----- DE 100 00 320 A1 (COGNIS DEUTSCHLAND GMBH [DE]) 12 July 2001 (2001-07-12) the whole document -----	1-14
2		

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2011/001579

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 0539980	A1	05-05-1993	CA 2081652 A1 DE 69220646 D1 DE 69220646 T2 DE 69231639 D1 DE 69231639 T2		01-05-1993 07-08-1997 02-01-1998 15-02-2001 31-05-2001
WO 2004073404	A1	02-09-2004	BR PI0407703 A CA 2516694 A1 CN 1750756 A DE 10307171 A1 EP 1596655 A1 HK 1087593 A1 JP 4564484 B2 JP 2006518349 T MX PA05008881 A US 2006264330 A1		14-02-2006 02-09-2004 22-03-2006 09-09-2004 23-11-2005 25-07-2008 20-10-2010 10-08-2006 05-10-2005 23-11-2006
WO 0108481	A1	08-02-2001	NONE		
WO 03003830	A1	16-01-2003	BR 0210779 A CA 2452297 A1 DE 10132459 A1 EP 1401273 A1 US 2004171492 A1		20-07-2004 16-01-2003 23-01-2003 31-03-2004 02-09-2004
DE 10000320	A1	12-07-2001	AU 3164301 A BR 0016923 A CA 2396051 A1 WO 0150861 A1 EP 1246531 A1		24-07-2001 31-12-2002 19-07-2001 19-07-2001 09-10-2002

---

フロントページの続き

(51) Int.Cl. F I テーマコード(参考)  
A 01 P 7/04 (2006.01) A 01 P 7/04

(81) 指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,R,S,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,IDL,IN,IS,JP,KE,KG,KM,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PE,PG,PH,PL,PT,RO,RS,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,ZA,ZM,ZW

(74) 代理人 100172605

弁理士 岩木 郁子

(72) 発明者 ザントラ・マック

ドイツ41352コルシェンプロイヒ、アム・トリーテンプロイヒ111番

(72) 発明者 ハンス - ゲオロク・マインツ

ドイツ42799ライヒリンゲン、フェルトシュトラーセ17番

(72) 発明者 インゴ・フロイテ - シュラハター

ドイツ45239エッセン、ルートゲルスシュトラーセ2番

Fターム(参考) 4H011 AA01 AC01 BB09 BB17 BC06 DA15 DA16 DD03 DF03