

(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2021-502995

(P2021-502995A)

(43) 公表日 令和3年2月4日 (2021. 2. 4)

(51) Int. Cl.	F 1	テーマコード (参考)
AO 1 N 47/36 (2006. 01)	AO 1 N 47/36 1 O 1	2 B 1 2 1
AO 1 P 13/00 (2006. 01)	AO 1 P 13/00	4 H O 1 1
AO 1 N 43/80 (2006. 01)	AO 1 N 43/80 1 O 2	
AO 1 M 21/04 (2006. 01)	AO 1 M 21/04 C	

審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 16 頁)

(21) 出願番号	特願2020-526885 (P2020-526885)	(71) 出願人	500239823
(86) (22) 出願日	平成30年11月16日 (2018. 11. 16)		エルジー・ケム・リミテッド
(85) 翻訳文提出日	令和2年5月15日 (2020. 5. 15)		大韓民国 07336 ソウル, ヨンドウ
(86) 国際出願番号	PCT/KR2018/014102		ンボーグ, ヨイードロ 128
(87) 国際公開番号	W02019/098755	(74) 代理人	100110364
(87) 国際公開日	令和1年5月23日 (2019. 5. 23)		弁理士 実広 信哉
(31) 優先権主張番号	10-2017-0153278	(74) 代理人	100122161
(32) 優先日	平成29年11月16日 (2017. 11. 16)		弁理士 渡部 崇
(33) 優先権主張国・地域又は機関	韓国 (KR)	(72) 発明者	キ・ヒョン・リュ
			大韓民国・テジョン・34122・ユソン
			ーグ・ムンジーロ・188・エルジー・ケ
			ム・リサーチ・パーク

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草剤組成物

(57) 【要約】

本発明は、化学式 1 で表されるピリジンスルホニルウレア化合物を活性成分として含み、前記ピリジンスルホニルウレア化合物は、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物で含まれ、前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が異性体混合物の 92 重量%以上で含まれる除草剤組成物に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

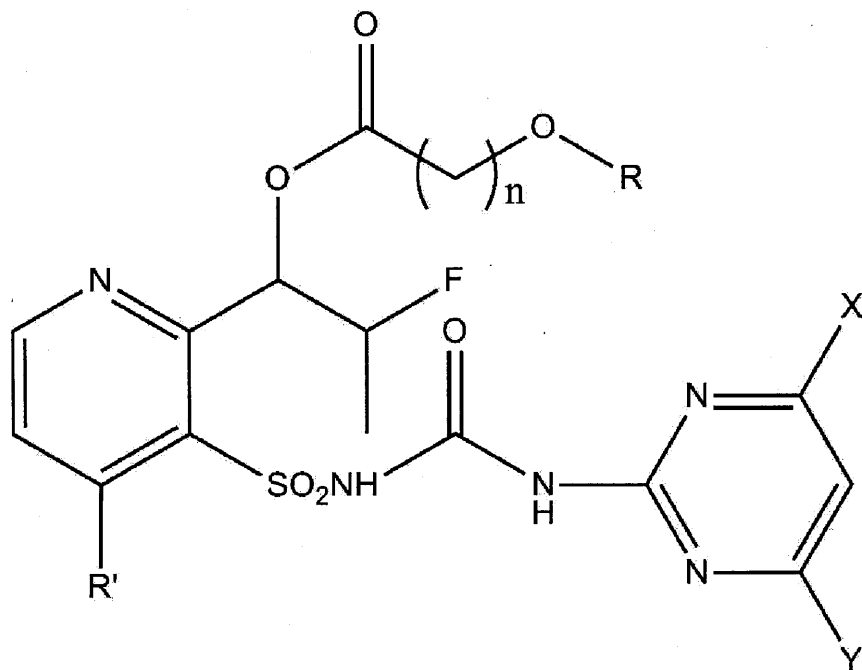
下記化学式 1 で表されるピリジンスルホニルウレア化合物を活性成分として含み、

前記ピリジンスルホニルウレア化合物は、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物で含まれ、

前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が前記異性体混合物の 9 2 重量%以上で含まれる除草剤組成物。

【化 1】

[化学式 1]



前記化学式 1 において、n は 1 から 3 の整数を示し、

R は、水素または炭素数 1 から 4 のアルキル基であり、

R' は、水素、炭素数 1 から 4 のアルキル基、炭素数 1 から 3 のハロアルキル基、ハロゲン基または炭素数 1 から 2 のアルコキシ基であり、

X 及び Y は、それぞれ独立して炭素数 1 から 2 のアルキル基、炭素数 1 から 2 のアルコキシ基、炭素数 1 から 2 のハロアルコキシ基またはハロゲン基である。

【請求項 2】

前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が異性体混合物の 9 5 重量%以上で含まれる、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 3】

前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が異性体混合物の 9 5 重量%から 9 9 重量%で含まれる、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 4】

前記化学式 1 において、n は、1 または 2 の整数であり、

R は、水素またはメチル基であり、

R' は、水素、ハロゲン基またはメチル基であり、

X 及び Y は、それぞれメトキシ基である、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 5】

前記化学式 1 において、n は、1 または 2 の整数であり、

R は、メチルであり、

R' は、水素、Cl、Br またはメチル基であり、

X 及び Y は、それぞれメトキシ基である、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 6】

前記化学式 1 で表されるピリジンスルホニルウレア化合物は、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-ヒドロキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-(3-ヒドロキシプロピオン)オキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-(3-メトキシプロピオン)オキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-メチル-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-クロロ-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、及び N-[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-プロモ-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミドからなる群から選択された少なくとも一つ以上である、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 7】

前記除草剤組成物は、液状水和剤、水面展開剤、水和剤、粒状水和剤、粉剤、散布剤、顆粒剤、粒剤及び錠剤からなる群から選択された少なくとも一つ以上の剤形に形成された、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 8】

前記除草剤組成物は、緩衝液、界面活性剤及び凍結防止剤をさらに含む液状水和剤 (Suspension concentrate、SC) の剤形に形成された、請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

〔関連出願の相互参照〕

本出願は、2017 年 11 月 16 日付韓国特許出願第 10-2017-0153278 号に基づく優先権の利益を主張し、当該韓国特許出願の文献に開示された全ての内容は本明細書の一部として含まれる。

【0002】

本発明は、優れた除草活性を示す除草活性成分を含む除草剤組成物に関する。

【背景技術】

【0003】

作物の栽培技術において、作物の成長を阻害する雑草を防除して作物を保護することは重要である。作物の栽培地で発生した雑草による作物の生育不振又は収量減少のような被害を減らすために、これらを効果的に防除でき、作物には安全な除草活性物質が開発されてきた。現在まで開発された多数の除草活性物質は、特定の作物用として登録され雑草防除用として用いられている。このような特定の作物の栽培地で発生する雑草の防除用として用いるための除草活性物質は、除草活性が高く、幅広い除草スペクトル (spectrum) を有し、且つ、環境及び作物には安全なものが好ましい。

【0004】

一方、前記のように除草活性物質を含む除草剤組成物は、水和剤 (wettable powder)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、粒状水和剤 (Water-dispersible granule)、粒剤 (granule

）、液状水和剤（Suspension concentrate）等の剤形として開発され、除草剤として用いられる。しかし、水和剤、乳剤、粒状水和剤の場合には、一般に水で所定の濃度で希釈されて散布液として製造されるが、散布液の量が多いので、対象の水田又は畑の全体表面に均一に散布するためには、過度な費用及び時間がかかるという問題点がある。粒剤の場合、そのまま直接用いることができるので、水和剤、乳剤及び粒状水和剤の問題点は解決できたが、全体除草剤を基準に除草活性物質の含量が比較的小さく、除草剤を形成するための補助剤が必須に含まれなければならない、粉碎、混合、捏和、造粒、乾燥、分級等、製造工程が複雑であり、散布のむら等が発生するという問題点がある。前記剤形等の問題点を克服するために、製造工程が比較的簡単であり、環境に優しく、且つ、散布時に簡素化、効率化が可能な液状水和剤（Suspension concentrate）の製剤が開発された。一方、このように多様な剤形の除草剤として活用されるとき、長期保管時にも除草剤組成物の安定性を確保することは重要な課題である。

10

【0005】

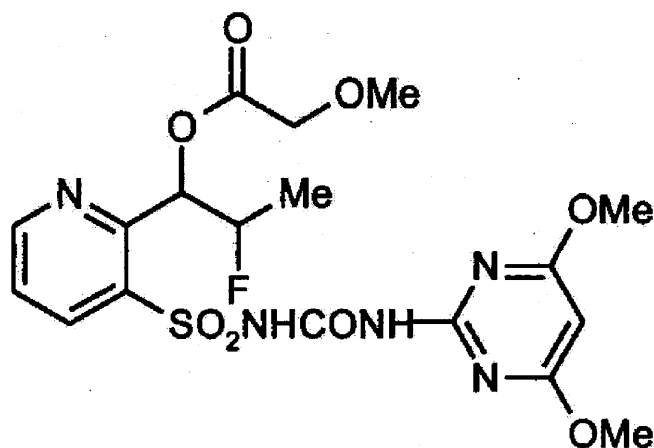
下記化学式 a の化合物〔ISO 提案名：フルセトスルフロン（flucetosulfuron）〕はスルホニルウレア系に属する除草活性物質であって、韓国特許第 10-0399366 号（出願番号第 10-2000-0059990 号）に除草活性物質として既に記述されている。

【0006】

【化 1】

20

〔化学式 a〕



30

【0007】

前記フルセトスルフロンは、稲、小麦、大麦（適正使用薬量：10～40 g a. i. / ha）及び芝生（適正使用薬量：50～200 g a. i. / ha）に対し土壌または茎葉処理時にこれらの作物に安全であり、広葉雑草、イネ科雑草、カヤツリグサ科雑草、一年生及び多年生雑草など広範囲な草種に対して殺草の効果に優れるものとして知られた物質である。

40

【0008】

しかし、前記のようなスルホニルウレア系に属する除草活性物質を含む除草剤組成物の安定性の確保が依然として問題となっている。特に、液状水和剤（Suspension concentrate, SC）の剤形の場合、高温保管の条件時に加水分解によって安定性がさらに落ちるので、長期保管が困難であるという問題点がある。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0009】

【特許文献 1】韓国特許第 10-0399366 号明細書

50

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0010】

本発明は、スルホニルウレア系に属する除草活性物質を含む除草剤組成物であって、優れた除草活性を有し、且つ安定性に優れるので、長期保管が可能な除草剤組成物の提供を図るものである。

【課題を解決するための手段】

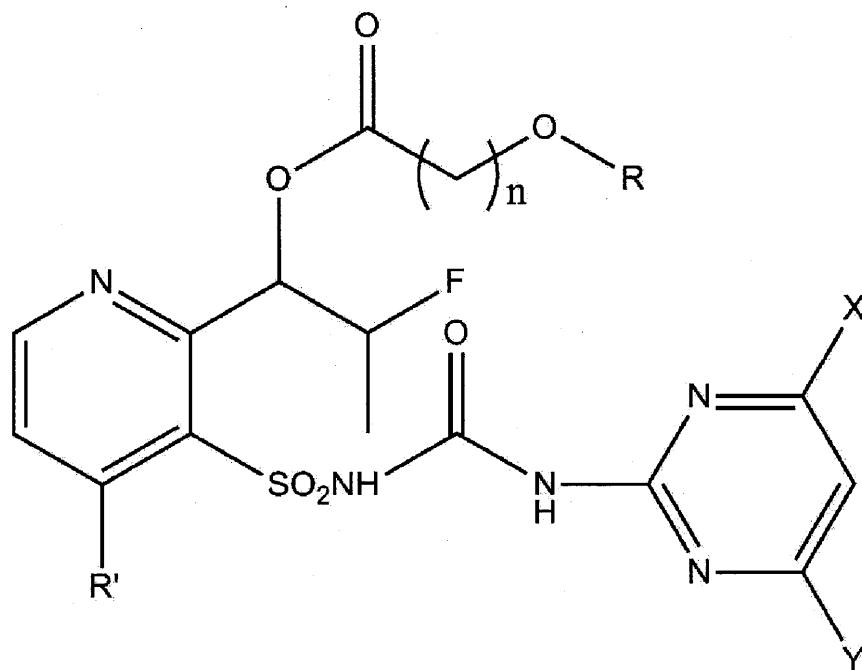
【0011】

本発明は、下記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物を活性成分として含み、前記ピリジンスルホニルウレア化合物は、エリスロ型（Erythro-form）及びスレオ型（threo-form）の異性体混合物で含まれ、前記エリスロ型（Erythro-form）が前記異性体混合物の92重量%以上で含まれる除草剤組成物を提供する。

【0012】

【化2】

[化学式1]



【0013】

nは、1から3の整数を示し、

Rは、水素または炭素数1から4のアルキル基であり、

R'は、水素、炭素数1から4のアルキル基、炭素数1から3のハロアルキル基、ハロゲン基または炭素数1から2のアルコキシ基であり、

X及びYは、それぞれ独立して炭素数1から2のアルキル基、炭素数1から2のアルコキシ基、炭素数1から2のハロアルコキシ基またはハロゲン基である。

【発明の効果】

【0014】

本発明によれば、優れた除草活性を有し、且つ長期の高温保管時にも分解率が低く、特に、液状水和剤（Suspension concentrate, SC）の剤形でも優れた安定性の確保が可能な除草剤組成物を提供することができる。

【発明を実施するための形態】

【0015】

以下、本発明に対する理解を助けるために本発明をさらに詳しく説明する。このとき、本明細書および特許請求の範囲で用いられている用語や単語は、通常のかつ辞書的な意味に限定して解釈されてはならず、発明者は自身の発明を最良の方法で説明するために、用語の概念を適宜定義することができるという原則に即して、本発明の技術的思想に適合する意味と概念に解釈されなければならない。

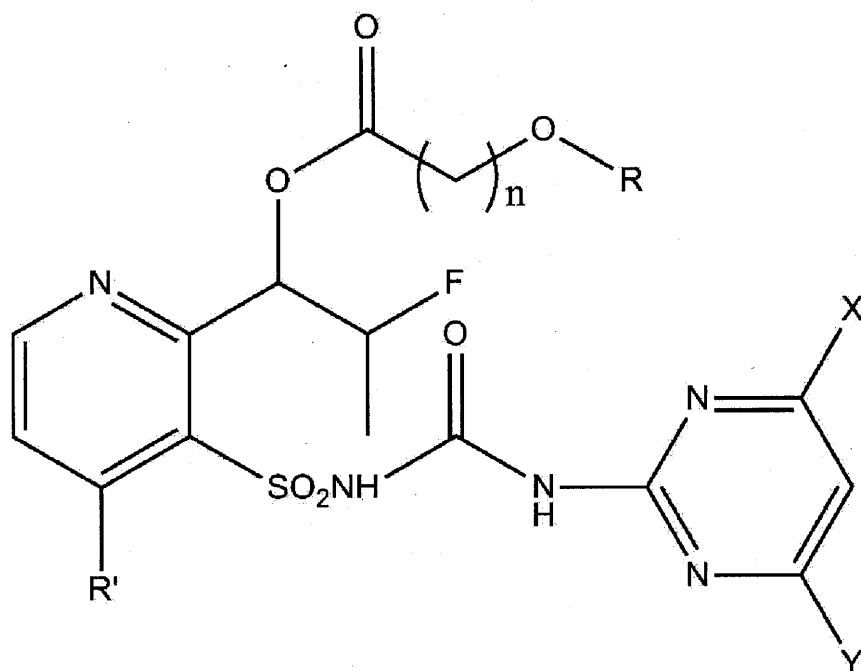
【0016】

本発明の除草剤組成物は、下記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物を活性成分として含み、前記ピリジンスルホニルウレア化合物は、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物で含まれ、前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が前記異性体混合物の92重量%以上で含まれる。

【0017】

【化3】

[化学式1]



【0018】

前記化学式1において、nは、1から3の整数を示し、Rは、水素または炭素数1から4のアルキル基であり、R'は、水素、炭素数1から4のアルキル基、炭素数1から3のハロアルキル基、ハロゲン基または炭素数1から2のアルコキシ基であり、X及びYは、それぞれ独立して炭素数1から2のアルキル基、炭素数1から2のアルコキシ基、炭素数1から2のハロアルコキシ基またはハロゲン基である。

【0019】

より好ましくは、前記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物は、前記化学式1において、nは、1または2の整数であり、Rは、水素またはメチル基であり、R'は、水素、ハロゲン基またはメチル基であり、X及びYは、それぞれメトキシ基であってよい。

【0020】

また、さらに好ましくは、前記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物は、前記化学式1において、nは1または2の整数であり、Rはメチルであり、R'は水素

、C1、Brまたはメチル基であり、X及びYはそれぞれメトキシ基であってよい。

【0021】

前記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物は、例えば、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-ヒドロキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-(3-ヒドロキシプロピオン)オキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-2-(2-フルオロ-1-(3-メトキシプロピオン)オキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-メチル-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、N-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-クロロ-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミド、及びN-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノカルボニル]-4-ブromo-2-(2-フルオロ-1-メトキシアセトキシ-n-プロピル)ピリジン-3-スルホンアミドからなる群から選択された少なくとも一つ以上であってよい。

10

【0022】

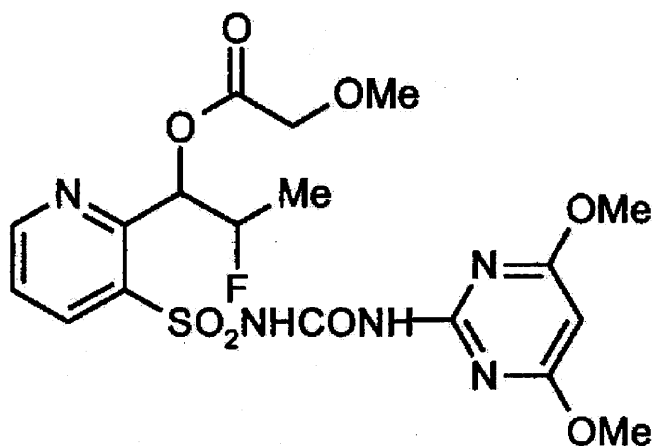
20

より好ましくは、前記化学式1で表されるピリジンスルホニルウレア化合物は、下記化学式2の化合物〔ISO提案名：フルセトスルフロニル(fluacetosulfuron)〕であってよい。

【0023】

【化4】

〔化学式2〕



30

【0024】

前記化学式1の化合物は、2つの非対称炭素を含んでいるので、エリスロ型(Erythro-form)またはスレオ型(threo-form)の異性体として存在し得る。

【0025】

本発明の除草剤組成物は、前記化学式1で表される化合物がエリスロ型(Erythro-form)及びスレオ型(threo-form)の異性体混合物で含まれ、このとき、前記エリスロ型(Erythro-form)が異性体混合物全体の92重量%以上で含まれる。より好ましくは、前記エリスロ型(Erythro-form)が異性体混

40

50

合物の95重量%以上で含まれてよく、さらに好ましくは、前記エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が異性体混合物の95重量%から99重量%で含まれてよい。

【0026】

このように、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物のうちエリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) を92重量%以上で含むことにより、優れた除草活性を有するだけでなく、長期の高温保管時にも分解率が落ちるので安定性を確保することができる。

【0027】

前記化学式1で表される化合物をエリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物の形態で含まず、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) の単独形態で含む場合、生産効率性が非常に落ちる問題があり、スレオ型 (t h r e o - f o r m) の単独形態で含む場合、除草活性が低下し、分解率が非常に増加するので安定性が低下する問題がある。また、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物で存在するが、異性体混合物のうちエリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) が92重量%未満で含まれる場合にも除草活性が低下し、分解率が増加する。特に、液状剤形の場合、加水分解により安定性がさらに落ちるので、長期の高温保管が困難な問題が発生する。

10

【0028】

本発明において、前記化学式1で表される化合物の異性体混合物を含む除草剤組成物は、通常の除草剤組成物の剤形で用いられてよい。前記異性体混合物を含む除草剤組成物は、必要な場合、担体、界面活性剤、または剤形の技術分野で一般に用いられる添加剤をさらに含むことで、多様な剤形の除草剤として活用され得る。前記担体及び添加剤は、固体または液体であってよく、剤形の技術分野で有用な成分、例えば天然または合成の無機物質、溶媒、分散剤、湿潤剤、接着剤、増粘剤、結合剤などであってよい。

20

【0029】

例えば、前記除草剤組成物は、液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e)、水面展開剤 (S p r e a d i n g o i l)、水和剤 (w e t t a b l e p o w d e r)、粒状水和剤 (W a t e r - d i s p e r s i b l e g r a n u l e)、粉剤 (D i s p e r s i b l e p o w d e r)、散布剤、顆粒剤、粒剤 (g r a n u l e) 及び錠剤 (t a b l e t) からなる群から選択された少なくとも一つ以上の剤形に形成されてよい。より好ましくは、液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e) であってよく、前記液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e) の場合、緩衝液、界面活性剤及び凍結防止剤をさらに含んで形成されてよい。液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e) の場合、一般に製造工程が比較的簡単であり、環境にやさしく、かつ散布時に簡素化、効率化が可能であるという長所があるが、加水分解による分解により安定性が落ちる問題があった。しかし、本発明の除草剤組成物は、エリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) 及びスレオ型 (t h r e o - f o r m) の異性体混合物のうちエリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) を92重量%以上で含むことにより、安定性を大きく向上させ、このような液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e) の剤形の場合にも加水分解による分解率を下げ、安定性を大きく向上させて、高温での長期保管ができるようにした。

30

40

【0030】

前記除草剤組成物の多様な剤形は、公知の方法により、例えば有効成分を溶媒、固体担体、界面活性剤またはその他の添加剤と緊密に混合及び／又は粉碎することで製造することができる。

【0031】

前記溶媒として使用可能なものは、芳香族炭化水素、例えばキシレン混合物または置換されたナフタレン；エタノール、エチレングリコール、エチレングリコールモノメチルエーテルまたはエチレングリコールモノエチルエーテルのようなアルコールとグリコール及びそのエーテルとエステル；シクロヘキサノンのようなケトン、N-メチル-2-ピロリ

50

ドン、ジメチルスルホキシドまたはジメチルホルムアミドのような強い極性溶媒及びエポキシ化されたヤシ油または大豆油のようなエポキシ化されているかエポキシ化されていない植物油；または水であってよい。このような溶媒は、液状剤形用溶媒または粒状製剤の補助溶媒として用いられてよい。

【0032】

前記散布剤及び粒状製剤に一般に用いられる固体担体は、通常、タルク、カオリン、モンモリロナイト、パイロフィライト、ベントナイト、または炭酸カルシウムのような粉碎された天然鉱物であるか、ゼオライトのような吸着性担体、または砂であってよい。それだけでなく、多数の予備粉碎された無機または有機物質を用いてよい。

【0033】

前記界面活性剤は、剤形化される化学式1の化合物の性質によって良好な分散、湿潤及び潤滑特性を示す非イオン性、陽イオン性及び／又は陰イオン性界面活性剤の中から選択されてよい。

【0034】

前記化学式1の化合物の異性体混合物を含む除草剤組成物を投与するより好ましい方法は、液状製剤で植物の生息地を濡らすか、活性成分を固体形態、例えば粒状製剤の形態で土壤に混入させることで（土壤処理）、根及び幹を介して土壤または水を経て植物体に到達させることである。または、植物の葉に直接投与することによっても除草活性を示すことができる（葉面投与）。投与回数及び投与率は、植物の生物学的特性及び気候、土壤環境によって変化し得る。

【0035】

本願は、今から特定の具体例に関して説明されるものであり、これは、本発明の範囲を制限しようとするものではない。逆に、本出願は、特許請求の範囲の範囲内に含まれる全ての代案及び変形をカバーする。よって、以下は、特定の具体例の例示の目的のために本出願の実行を例示するものであり、その過程及び概念的様態の有用で且つ容易に理解された説明であると考えられるものを提供するために提示される。

【0036】

以下の実施例は、当業者に本願で提供される化合物、組成物、及び方法がどのように作られて評価されるかの完全な開示及び説明を提供するために提示され、単に例示的なものとして意図される。よって、実施例は、決して発明者が彼らの発明と見做すものの範囲を制限するためのものではない。反応条件、例えば、構成要素の濃度、所望の溶媒、溶媒混合物、温度、圧力、及び他の反応パラメータ及び純度、収率等のような生成物特性を最適化するために用いられ得る条件の多くの変形及び組み合わせがある。このようなものは、また、本願の範囲内にあるものと見做される。全ての可能な変化において、前記説明された要素の如何なる組み合わせも、本願で異なって指示されていないか、文脈上異なって明らかに否認されていなければ、本発明によって含まれる。

【実施例】

【0037】

実施例1

K_2HPO_4 及び KH_2PO_4 に水を補充して総1Lの溶液を作り、0.1Mのホスファート（phosphate）緩衝液を製造した。その後、緩衝液65.8重量部にCR-DOS70P（Di（2-ethylhexyl）sulfosuccinate、sodium salt、Cas no. 577-11-7）3.0重量部、NK-SU500（sucrose laurate、cas no. 25339-99-5）1.0重量部、消泡剤SAG-622（モメンティブ社製）0.2量部を入れて十分に混合し、均一な状態で1-（3-（4，6-ジメトキシピリミジン-2-イル）カルバモイル）スルファモイル}-2-ピリジニル}-2-フルオロプロピルメトキシアセテート（Flucetosulfuron、FTS）のエリスロ型（Erythro-form）を96重量%、スレオ型（threo-form）を4重量%で含む異性体混合物10.0重量部を入れ、攪拌機を用いて十分に混合した。ここにガラスビーズ（Glass

10

20

30

40

50

bead)を入れて粉碎を行い、粒子サイズの平均値が1～2 μmになるまで進めて湿式部を製造した。

【0038】

次に、P. G (propylene glycol、cas no. 57-55-6) 3.0重量部にX. G (Xanthan Gum、cas no. 11138-66-2) 0.1重量部、M. V [5-クロロ-2-メチル-4-イソチアゾリン-3-オン (cas no. 26172-55-4) と2-メチル-4-イソチアゾリン-3-オン (cas no. 2682-20-4)] 0.2重量部を入れて十分に攪拌した。その後、0.1Mのホスファート (phosphate) 緩衝液16.7重量部を入れて十分に攪拌し、増粘部を製造した。

10

【0039】

次に、前記湿式部70重量部に増粘部30重量部を入れて十分に攪拌し、液状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

【0040】

実施例2

FTSとしてエリスロ型 (Erythro-form) を92重量%、スレオ型 (threo-form) を8重量%で含む異性体混合物を混合したことを除き、実施例1と同様に行って液状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

【0041】

実施例3

CR-PE62 (Polyethylene-Polypropylene glycol、Cas no. 9003-11-6) 15重量部をcelite 281 (Calcined Diatomite、Cas no. 91053-39-3) 20重量部に吸着させた後、1-(3-{[(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)カルバモイル]スルファモイル}-2-ピリジニル)-2-フルオロプロピルメトキシアセテート (Flucetosulfuron、FTS) のエリスロ型 (Erythro-form) を96重量%、スレオ型 (threo-form) を4重量%で含む異性体混合物10重量部、NK-EFW (2-Naphthalenesulfonic acid、polymer with formaldehyde、Sodium salt、Cas no. 36290-04-7) 2重量部、NK-D425 (2-Naphthalenesulfonic acid、polymer with formaldehyde、Sodium salt、Cas no. 36290-04-7) 3重量部、CR-SDS (sodium dodecyl sulfate、Cas no. 151-21-3) 1重量部、CR-UF100F (Urea-formaldehyde resin (CAS no. 9011-05-6)) 10重量部を混合し、組成物の合計が100重量部になるように残部のタルク (Talc) を混合した後、エアジェットミル (Air-jet mill) を用いて粉碎した。粉碎された混合物に水10～12重量部を入れて練った後、造粒機 (Granulator) を用いて粒子化し、80℃内外の温度で熱風乾燥して粒状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

20

30

【0042】

比較例1

FTSとしてエリスロ型 (Erythro-form) を88重量%、スレオ型 (threo-form) を12重量%で含む異性体混合物を混合したことを除き、実施例1と同様に行って液状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

40

【0043】

比較例2

FTSとしてエリスロ型 (Erythro-form) を85重量%、スレオ型 (threo-form) を15重量%で含む異性体混合物を混合したことを除き、実施例1と同様に行って液状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

【0044】

50

比較例 3

F T Sとしてエリスロ型 (E r y t h r o - f o r m) を 8 8 重量%、スレオ型 (t h r e o - f o r m) を 1 2 重量%で含む異性体混合物を混合したことを除き、実施例 3 と同様に行って粒状水和剤の剤形の除草剤組成物を製造した。

【0045】〔実験例：除草剤組成物の保存安定性の評価〕

前記実施例 1 から 3 及び比較例 1 から 3 の除草剤組成物に対する保存安定性の評価のために、液状試料はポリエチレン (P E) 材質のプラスチック瓶に、粒状試料は銀箔封筒にそれぞれ約 1 0 0 g 満たし、密封してから 5 4 (± 2) °C に維持されるオープンにそれぞれ 4 週間保管した後、H P L C (製造社: W a t e r s) で活性成分の面積値を測定して分解率を評価した。その結果を下記表 1 に示した。

10

【0046】

H P L C 分析条件は、以下の通りである。

C o l u m n : 1 0 0 m m × 4 . 6 m m i . d . 「C a p c e l l P a k」C 1 8 c o l u m n , 3 μ m p a r t i c l e s

M o b i l e P h a s e : a c e t o n i t r i l e / w a t e r (0 . 0 2 M a m m o n i u m a c e t a t e + 0 . 1 M a c e t i c a c i d) = 3 2 / 6 8

F l o w : 1 . 0 m L / m i n .

C o l u m n T e m p e r a t u r e : 3 0 ° C

I n j e c t i o n V o l u m e : 1 0 μ l

D e t e c t o r W a v e l e n g t h : 2 5 4 n m

R u n t i m e : 2 0 m i n .

20

【0047】【表 1】

	5 4 ° C で 4 週間保管後の分解率 (%)
実施例 1	6 . 8 9
実施例 2	9 . 8 2
実施例 3	1 3 . 6 3
比較例 1	9 . 9 4
比較例 2	1 2 . 2 4
比較例 3	1 7 . 8 5

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/KR2018/014102

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER <i>A01N 47/38(2006.01)i, A01N 25/14(2006.01)i, A01N 25/12(2006.01)i, A01N 25/30(2006.01)i, A01N 25/02(2006.01)i</i> According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N 47/38; A01N 25/04; A01N 25/30; A01N 43/40; A01N 47/36; C07D 401/12; A01N 25/14; A01N 25/12; A01N 25/02 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Korean Utility models and applications for Utility models: IPC as above Japanese Utility models and applications for Utility models: IPC as above Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) eKOMPASS (KIPO internal) & Keywords: pyridinesulfonylureas, herbicide, erythro-form, threo-form, isomer		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 6806229 B1 (KOO, Suk-Jin et al.) 19 October 2004 See claims 1-4, 8; column 3, lines 62-67, column 7, lines 26-59.	1-8
A	KR 10-1996-0011389 B1 (KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY) 22 August 1996 See the entire document.	1-8
A	KR 10-2017-0105530 A (MITSUI AGRISCIENCE INTERNATIONAL S.A./N.V. et al.) 19 September 2017 See the entire document.	1-8
A	WO 2016-102504 A1 (MITSUI AGRISCIENCE INTERNATIONAL S.A./N.V.) 30 June 2016 See the entire document.	1-8
A	KR 10-2008-0033377 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.) 16 April 2008 See the entire document.	1-8
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "I" 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) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "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 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot 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 "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 21 FEBRUARY 2019 (21.02.2019)		Date of mailing of the international search report 22 FEBRUARY 2019 (22.02.2019)
Name and mailing address of the ISA/KR  Korean Intellectual Property Office Government Complex Daejeon Building 4, 189, Cheongse-ro, Seo-gu, Daejeon, 35208, Republic of Korea Facsimile No. +82-42-481-8578		Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/KR2018/014102

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member	Publication date
US 6806229 B1	19/10/2004	AT 261440 T AU 2002-966100 A AU 760178 B2 CN 100172931 C CN 100377345 A CN 103066977 A CN 103066977 B CN 202455071 U DE 60008935 T2 EP 1334099 A1 EP 1334099 B1 JP 2004-511478 A JP 3734796 B2 WO 02-30921 A1	15/03/2004 22/04/2002 08/05/2003 27/10/2004 30/10/2002 24/04/2013 18/02/2015 26/09/2012 05/01/2005 13/08/2003 10/03/2004 15/04/2004 11/01/2006 18/04/2002
KR 10-1996-0011389 B1	22/08/1996	KR 10-1994-0023894 A	17/11/1994
KR 10-2017-0105530 A	19/09/2017	AU 2017-371074 A1 BR 112017013448 A2 CA 2971795 A1 CN 107427010 A EA 201791345 A1 EP 3236749 A1 EP 3387904 A1 JP 2018-502109 A MX 2017008371 A US 2018-0000069 A1 WO 2016-102499 A1	27/07/2017 09/01/2018 30/06/2016 01/12/2017 31/01/2018 01/11/2017 17/10/2018 25/01/2018 30/04/2018 04/01/2018 30/06/2016
WO 2016-102504 A1	30/06/2016	EP 3236750 A1	01/11/2017
KR 10-2008-0033377 A	16/04/2008	CN 101237770 A CN 101237770 B JP 2007-254453 A JP 5137349 B2 KR 10-1246484 B1 WO 2007-018160 A1	06/08/2008 01/02/2012 04/10/2007 06/02/2013 25/03/2013 15/02/2007

국제조사보고서		국제출원번호 PCT/KR2018/014102
A. 발명이 속하는 기술분류(국제특허분류(IPC)) A01N 47/38(2006.01)i, A01N 25/14(2006.01)i, A01N 25/12(2006.01)i, A01N 25/30(2006.01)i, A01N 25/02(2006.01)i		
B. 조사된 분야 조사된 최소문헌(국제특허분류를 기재) A01N 47/38; A01N 25/04; A01N 25/30; A01N 43/40; A01N 47/36; C07D 401/12; A01N 25/14; A01N 25/12; A01N 25/02 조사된 기술분야에 속하는 최소문헌 이외의 문헌 한국등록실용신안공보 및 한국공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC 일본등록실용신안공보 및 일본공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC 국제조사에 이용된 전산 데이터베이스(데이터베이스의 명칭 및 검색어(해당하는 경우)) eKOMPASS(특허청 내부 검색시스템) & 키워드: 피리딘설폰닐우레아, 제초제, 에리스로형, 스테오형, 이성질체		
C. 관련 문헌		
카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
X	US 6806229 B1 (KOO, SUK-JIN 등) 2004.10.19 청구항 1-4, 8; 컬럼 3, 라인 62-67, 컬럼 7, 라인 26-59 참조.	1-8
A	KR 10-1996-0011389 B1 (재단법인한국화학연구소) 1996.08.22 전체 문헌 참조.	1-8
A	KR 10-2017-0105530 A (미츠이 에그리사이언스 인터내셔널 에스.에이./엘.브이. 등) 2017.09.19 전체 문헌 참조.	1-8
A	WO 2016-102504 A1 (MITSUI AGRISCIENCE INTERNATIONAL S.A./N.V.) 2016.06.30 전체 문헌 참조.	1-8
A	KR 10-2008-0033377 A (이시하라 산교 가부시끼가이샤) 2008.04.16 전체 문헌 참조.	1-8
☐ 추가 문헌이 C(계속)에 기재되어 있습니다. ☒ 대응특허에 관한 별지를 참조하십시오.		
* 인용된 문헌의 특별 카테고리: “A” 특별히 관련이 없는 것으로 보이는 일반적인 기술수준을 정의한 문헌 “B” 국제출원일보다 빠른 출원일 또는 우선일을 가지나 국제출원일 이후에 공개된 선출원 또는 특허 문헌 “L” 우선권 주장에 의문을 제기하는 문헌 또는 다른 인용문헌의 공개일 또는 다른 특별한 이유(이유를 명시)를 밝히기 위하여 인용된 문헌 “O” 구두 개시, 사용, 전시 또는 기타 수단을 언급하고 있는 문헌 “P” 우선일 이후에 공개되었으나 국제출원일 이전에 공개된 문헌 “T” 국제출원일 또는 우선일 후에 공개된 문헌으로, 출원과 상충하지 않으며 발명의 기초가 되는 원리나 이론을 이해하기 위해 인용된 문헌 “X” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌 하나만으로 청구된 발명의 신구성 또는 진보성이 없는 것으로 본다. “Y” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌이 하나 이상의 다른 문헌과 조합하는 경우로 그 조합이 당업자에게 자명한 경우 청구된 발명은 진보성이 없는 것으로 본다. “&” 동일한 대응특허문헌에 속하는 문헌		
국제조사의 실제 완료일 2019년 02월 21일 (21.02.2019)		국제조사보고서 발송일 2019년 02월 22일 (22.02.2019)
ISA/KR의 명칭 및 우편주소 대한민국 특허청 (35208) 대전광역시 서구 청사로 189, 4동 (둔산동, 정부대전청사) 팩스 번호 +82-42-481-8578		심사관 감유림 전화번호 +82-42-481-3516

서식 PCT/ISA/210 (두 번째 용지) (2015년 1월)

국제조사보고서
대응특허에 관한 정보

국제출원번호
PCT/KR2018/014102

국제조사보고서에서 인용된 특허문헌	공개일	대응특허문헌	공개일
US 6806229 B1	2004/10/19	AT 261440 T AU 2002-966100 A AU 760178 B2 CN 100172931 C CN 100377345 A CN 103066977 A CN 103066977 B CN 202455071 U DE 60008935 T2 EP 1334099 A1 EP 1334099 B1 JP 2004-511478 A JP 3734796 B2 WO 02-30921 A1	2004/03/15 2002/04/22 2003/05/08 2004/10/27 2002/10/30 2013/04/24 2015/02/18 2012/09/26 2005/01/05 2003/08/13 2004/03/10 2004/04/15 2006/01/11 2002/04/18
KR 10-1996-0011389 B1	1996/08/22	KR 10-1994-0023894 A	1994/11/17
KR 10-2017-0105530 A	2017/09/19	AU 2017-371074 A1 BR 112017013448 A2 CA 2971795 A1 CN 107427010 A EA 201791345 A1 EP 3236749 A1 EP 3387904 A1 JP 2018-502109 A MX 2017008371 A US 2018-0000069 A1 WO 2016-102499 A1	2017/07/27 2018/01/09 2016/06/30 2017/12/01 2018/01/31 2017/11/01 2018/10/17 2018/01/25 2018/04/30 2018/01/04 2016/06/30
WO 2016-102504 A1	2016/06/30	EP 3236750 A1	2017/11/01
KR 10-2008-0033377 A	2008/04/16	CN 101237770 A CN 101237770 B JP 2007-254453 A JP 5137349 B2 KR 10-1246484 B1 WO 2007-018160 A1	2008/08/06 2012/02/01 2007/10/04 2013/02/06 2013/03/25 2007/02/15

서식 PCT/ISA/210 (대응특허 추가용지) (2015년 1월)

フロントページの続き

(81)指定国・地域 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ

(72)発明者 サム・チェ・チョン

大韓民国・テジョン・34122・ユソング・ムンジーロ・188・エルジー・ケム・リサーチ
・パーク

Fターム(参考) 2B121 AA19 CC05

4H011 AB01 BB10 BB14 BC03 BC07 BC08 BC18 BC19 BC20 DA15
DH14