

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7071515号

(P7071515)

(45)発行日 令和4年5月19日(2022.5.19)

(24)登録日 令和4年5月10日(2022.5.10)

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 N 25/00 (2006.01)

A 0 1 N 25/00 1 0 1

A 0 1 N 43/54 (2006.01)

A 0 1 N 43/54 F

A 0 1 P 13/00 (2006.01)

A 0 1 P 13/00

A 0 1 N 57/20 (2006.01)

A 0 1 N 57/20 G

A 0 1 N 57/20 L

請求項の数 15 (全36頁)

(21)出願番号 特願2020-542330(P2020-542330)

(86)(22)出願日 平成31年3月5日(2019.3.5)

(65)公表番号 特表2021-512134(P2021-512134
A)

(43)公表日 令和3年5月13日(2021.5.13)

(86)国際出願番号 PCT/KR2019/002536

(87)国際公開番号 WO2019/172617

(87)国際公開日 令和1年9月12日(2019.9.12)

審査請求日 令和2年8月4日(2020.8.4)

(31)優先権主張番号 10-2018-0026316

(32)優先日 平成30年3月6日(2018.3.6)

(33)優先権主張国・地域又は機関
韓国(KR)

(73)特許権者 517211447

ファームハンノン・カンパニー・リミテ
ッド

FARMHANNONG CO., LTD.

大韓民国 0 7 3 2 0 ソウル、ヨンドゥン
ボグ、ヨイデロ 2 4 番

(74)代理人 100108453

弁理士 村山 靖彦

(74)代理人 100110364

弁理士 実広 信哉

(74)代理人 100133400

弁理士 阿部 達彦

(72)発明者 ジュン・クク・オム

大韓民国・テジョン・3 4 0 4 8・ユソ
最終頁に続く

(54)【発明の名称】 ピリミジンジオン系化合物を含む除草剤組成物

(57)【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ピリミジンジオン系化合物を含む除草活性化合物；及び前記除草活性化合物に対する薬効増進剤を含み、

前記薬効増進剤は、

エトキシレート系 C₁₂₋₁₄ アルコール (Alcohols、C₁₂₋₁₄ ethoxylated)、プロポキシレート系 C₉₋₁₁ アルコールエトキシレート (Alcohols C₉₋₁₁ ethoxylated propoxylated)、1 Dodecanaminium、N (carboxymethyl) N,N dimethyl、inner salt と 1 Tetradecanaminium、N (carboxymethyl) N,N dimethyl、inner salt、グリセリン (glycerine) 及び水の混合物、プロピレンオキシドエチレンオキシドポリマーオクチルエーテル (Propylene oxide ethylene oxide polymer octyl ether)、有機シリコンエトキシレート系 (Organosilicone ethoxylates)、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル系 (Polyoxyethylene polyoxypropylene alkylether 系)、脂肪アミンエトキシレート系 (Fatty amine ethoxylates)、モノ (2 プロピルヘプチル) エーテル系オキシランメチルオキシランポリマー (Oxirane、methyl、polymer with oxirane、mono (2 propylheptyl) ether)、4 級

アンモニウム塩 (Quaternary ammonium salt)、ポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル系 (Polyoxyethylene sorbitan alkylester) 化合物、メチル化大豆油 (Methylated soybean oil) 化合物、エチル及びメチルエステルカナラ油 (Ethyl and Methyl esters of Canola Oil)、作物油濃縮物 (Crop Oil Concentrate) 及びこれらの組み合わせからなる群から選択され、

前記ピリミジンジオン系化合物は、チアフェナシルであり、

組成物全体 100 重量%を基準にして、前記薬効増進剤は 14 重量%ないし 20 重量%含まれる除草剤組成物。

【請求項 2】

前記除草活性化合物をグリホサート及びグルホシネートからなる群から選択される一つ以上をさらに含む請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 3】

前記除草剤組成物は、界面活性剤、溶剤、消泡剤、凍結防止剤、増粘剤、増量剤、pH 調節剤または防腐剤をさらに含む請求項 1 に記載の除草剤組成物。

【請求項 4】

前記界面活性剤は、エトキシ化ひまし油 (Castor oil、ethoxylates)、ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル (Polyoxyethylene Tristyrylphenyl Ether)、エトキシ化脂肪族アルコール (Ethoxylated Fatty alcohol)、エトキシ化アルキルフェノール (Alkylphenol ethoxylates)、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 (EO/PO Block copolymer)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びエトキシ化ひまし油のブレンド (Blend of Dodecylbenzenesulfonic acid、calcium salt and Castor oil ethoxylates)、ポリエチレン ポリプロピレングリコール、モノブチルエーテル (Polyethylene polypropylene glycol、monobutyl ether)、エトキシ化された C₁₂₋₁₅ アルコール (Alcohols、C₁₂₋₁₅、ethoxylated)、メチルメタクリレート メタクリル酸 モノメトキシポリエチレングリコールメタクリレート共重合体 (Methyl methacrylate methacrylic acid monomethoxypolyethylene glycol methacrylate copolymer)、ポリオキシアルキレンアミン誘導体 (Polyoxyalkylene amine derivative)、ポリオキシエチレントリスチリルフェノールフォスフェートカリウム塩 (Polyoxyethylene tristyrylphenol phosphate、potassium salt)、ポリ (オキシエチレン) トリスチリルフェニルエーテル及びトリエタノールアミン化合物 (Triethanolamine、compd with poly(oxyethylene) tristyrylphenyl ether)、メタクリル酸 メチルメタクリレート ポリエチレングリコールメチルエーテルメタクリレート共重合体 (Methacrylic acid methyl methacrylate polyethylene glycol methyl ether methacrylate copolymer)、ナフタレンスルホン酸ホルムアルデヒドとの重合体、ナトリウム塩 (Naphthalenesulfonic acid、polymer with formaldehyde、sodium salt)、ノニルフェノールエトキシ化された硫酸含有モノエーテル、ナトリウム塩 (Nonylphenol、ethoxylated、monoether with sulfuric acid、sodium salt)、ナトリウムビス (2-エチルヘキシル) スルホサクシネート (Sodium bis (2-ethylhexyl) sulfosuccinate)、ポリオキシエチレン ポリオキシプロピレン共重合体 (Polyoxyethylene polyoxypropylene copolymer)、2-エチルヘキシル D-グルコピラノシド ([a

10

20

30

40

50

lpha] D glucopyranoside、2 ethylhexyl)、フェノールスルホン酸ホルムアルデヒドフェノールウレア重合体、ナトリウム塩 (Phenolsulfonic acid formaldehyde phenol urea polymer、sodium salt)、ジイソブチルナフタレンスルホン酸、ナトリウム塩 (Diisobutyl naphthalenesulfonic acid、sodium salt)、ショ糖モノラウレート (Sucrose monolaurate)、ポリ(オキシ 1,2 エタンジイル)、トリス(1 フェニルエチル)フェニルヒドロキシ フォスフェート、カリウム塩 (Poly(oxy 1,2 ethanediy l)、alpha tris(1 phenylethyl) phenyl omega hydroxy phosphate、potassium salt)、ポリアミノアミドアルコキシ化縮合物 (Polyaminoamide alkoxylated condensates)、ポリエトキシ化トリスチリル及びジスチリルフェノールのリン酸エステル (Phosphoric acid esters of polyethoxylated tristyryl and distyryl phenol)、2 プロペン酸、2 メチル、ブチル 2 プロペノエート及びエチルベンゼンを有する重合体、ナトリウム塩 (2 Propenoic acid、2 methyl、polymer with butyl 2 propenoate and ethenylbenzene、sodium salt)、スルホン酸 C14 16 アルカンヒドロキシ及び C14 16 アルケン、ナトリウム塩 (Sulfonic acids、C14 16 alkane hydroxy and C14 16 alkene、sodium salts)、リグノスルホン酸、ナトリウム塩 (Lignosulfonic acid、sodium salt)、二ナトリウム塩硫酸 (Sulfuric acid、disodium salt)、ナトリウム塩アクリル酸重合体 (Acrylic acid polymer、sodium salt)、ナトリウム塩ドデシルスルフェート (Dodecyl sulfate、sodium salt)、ウレアホルムアルデヒド樹脂 (Urea formaldehyde resin)、ポリエチレングリコールモノ(トリスチリルフェニル)エーテル (Polyethylene glycol mono(tristyryl phenyl) ether)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩 (Dodecyl benzenesulfonic acid、calcium salt)、ナトリウムステアレート (Sodium stearate) 及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項 3 に記載の除草剤組成物。

【請求項 5】

前記溶剤は、ガンマブチロラクトン (Gamma butyrolactone)、N,N ジメチルデカンアミド (N,N Dimethyl Decanamide)、ジメチルスルホキシド (Dimethyl sulfoxide)、安息香酸ブチル (Butyl benzoate)、マレイン酸 2-エチルヘキシル (2 Ethylhexyl Maleate)、2 エチルヘキシルアルコール (2 Ethylhexyl Alcohol)、プロピレンカーボネート (Propylene carbonate)、ソルベントナフサ高沸点芳香族 (Solvent Naphtha(petroleum)、heavy aromatic)、シクロヘキサノン (Cyclohexanone)、プロピレングリコール環状炭酸塩 (Propylene glycol cyclic carbonate)、アセトフェノン (Acetophenone)、2 エチルヘキシルアセテート (2 Ethylhexyl acetate)、エチルエステル乳酸 (Lactic acid、ethyl ester)、アクリル酸テトラヒドロフルフリル (Tetrahydrofurfuryl acrylate)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項 3 に記載の除草剤組成物。

【請求項 6】

前記消泡剤は、ジメチルシリコン及びシロキサン (Silicones and siloxanes、dimethyl)、シロキサン及びシリコン、シリカとジメチル反応生成物 (Siloxanes and Silicones、di Me reacti

on products with silica)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

【請求項7】

前記増粘剤は、スメクタイト系無機質(Smectite group minerals)、二酸化珪素(Silicon dioxide)、酸化マグネシウム(Magnesium oxide)、フラー土(Fuller's earth)、キサンタンガム(Xanthan gum)、カルボキシメチルセルロース(Carboxymethyl cellulose)、2-ヒドロキシエチルエーテルセルロース(Cellulose 2-hydroxyethyl ether)、アラビアガム(Gum Arabic)、アクリル酸重合体(Acrylic acid polymer)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

10

【請求項8】

前記増量剤は、塩化カリウム(Potassium chloride)、フラックスか焼された珪藻土(Diatomaceous earth、flux calcined)、か焼された珪藻土(Diatomaceous earth、calcined)、カオリン(Kaoline)、ベントナイト(Bentonite)、尿素(Urea)、滑石(Talc)、珪藻土(1%未満の結晶質シリカ)(Diatomaceous earth (less than 1% crystalline silica))、用水(Water)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

20

【請求項9】

前記pH調節剤は、水酸化ナトリウム(Sodium hydroxide)、水酸化カリウム(Potassium hydroxide)、リン酸(Phosphoric acid)、クエン酸(Citric acid)、EDTA acid(EDTA 酸)及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

【請求項10】

前記凍結防止剤は、プロピレングリコール(Propylene glycol)、エチレングリコール(Ethylene glycol)、グリセリン(Glycerine)、2,3-ブタンジオール(2,3-butandiol)及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

30

【請求項11】

前記防腐剤は、5-クロロ-2-メチル3-(2H)-イソチアゾロン(3-(2H)-Isothiazolone、5-chloro-2-methyl)、2-メチル3-(2H)-イソチアゾロン(3-(2H)-Isothiazolone、2-methyl)、1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(1,2-Benzisothiazolin-3-one)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される請求項3に記載の除草剤組成物。

【請求項12】

前記除草剤組成物が水和剤、乳剤、乳濁剤、微濁液、液剤、酸性液剤、顆粒水和剤、または液状水和剤であることを特徴とする請求項1に記載の除草剤組成物。

40

【請求項13】

前記薬効増進剤がエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols、C₁₂₋₁₄ethoxylated)またはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated propoxylated)である請求項1に記載の除草剤組成物。

【請求項14】

チアフェナシル及びグルホシネートを含む除草活性化合物及び組成物全体100重量%を基準にして、3重量%ないし7重量%のエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols、C₁₂₋₁₄ethoxylated)またはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated)

50

propoxylated)を含む薬効増進剤を含む除草剤組成物。

【請求項15】

チアフェナシル及びグリホサートを含む除草活性化合物及び組成物全体100重量%を基準にして、3重量%ないし7重量%の薬効増進剤を含み、

前記薬効増進剤は、1 Dodecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、1 Tetradecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、Glycerine及び水の混合物を含む除草剤組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

10

【0001】

本発明は、ピリミジンジオン(Pyrimidinedione)系化合物を含む除草剤組成物に関する。

【背景技術】

【0002】

農業の生産性向上及び省力化に雑草の防除は非常に重要な役目をし、今まで様々な種類の除草剤が使われてきた。その中で代表的な非選択性除草剤では、パラコート(paraquat)液剤、グリホサート(glyphosate)液剤、グルホシネート(glufosinate)液剤などがある。しかし、パラコート液剤は人畜に対する致命的毒性によって国内での販売が禁じられ、グリホサート液剤の場合は発癌可能性の問題が提起され、薬剤に抵抗性を持つ雑草が生じて雑草の防除に困難があり、グルホシネート液剤は果樹園及び非農耕地で非選択性除草剤で一部の草を防除することができず、問題となる複数の雑草を防除するためには高い薬量を処理しなければならない問題があるため、このような問題点をいずれも解決できる高性能薬剤の開発が要求される実情である。

20

【0003】

このような既存の非選択性除草剤が持っている人畜毒性、抵抗性雑草の発生、高い薬量処理などの問題点を解決することができるピリミジンジオン系化合物が開発され、ピリミジンジオン系化合物は、薬剤が雑草の葉や茎に接すると接触した部位を殺す効果がある。しかし、この薬剤は浸透移行性がほとんどなく、葉緑素が少ない雑草や雑草の組織及びイネ科雑草にやや活性が低い短所がある。

30

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

接触性薬剤の除草活性及び薬効発現速度を高め、使用薬量を減らすための薬効増進組成物の開発が要求されている。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、ピリミジンジオン系化合物を除草剤で使用することにあたり、除草効果の発現速度を高め、使用薬量を減らして除草剤としての活用度を著しく高められる最適の薬効増進剤を開発し、薬効増進剤を含む除草剤組成物を提供することを目的とする。

40

【0006】

本発明のまた別の目的は、理化学物性が良好で製品安定性を確保したピリミジンジオン系化合物を含む様々な剤形の除草剤組成物を提供することである。

【発明の効果】

【0007】

本発明の除草剤組成物は、活性成分であるピリミジンジオン系化合物の除草効果を原剤に対して20%以上上昇させることができる薬効増進剤を含むことで、生物学的効果を増大させることができる。また、薬剤が雑草内部に早く浸透するように誘導して除草剤の生物活性を著しく向上させることができる。

【0008】

50

また、前記向上された展着能力と浸透力によって本発明の除草剤組成物は広葉雑草に対して著しく向上された展着力を有するだけでなく、細葉雑草に対しても改善された防除価を示すことができる。

【0009】

また、前記除草剤組成物が微濁液、液状水和剤、顆粒水和剤など様々な剤形で薬効を発現することができるよう、薬効増進剤を含んで3年以上安定した状態を維持することができる貯蔵安定性を保有した処方を確認した。また、活性成分が希釈液に均一に分散されていて薬剤処理の際に均一で優れる薬効を示すようにした。

【0010】

本発明の除草剤組成物は、最近グリホサート除草剤など既存除草剤の反復使用によって発生した抵抗性雑草に対しても低い薬量で効果的な防除が可能である。

10

【発明を実施するための形態】

【0011】

本発明の一具現例において、ピリミジンジオン系化合物を含む除草活性化合物及び前記除草活性化合物に対する薬効増進剤を含む除草剤組成物を提供し、前記薬効増進剤は、エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols、C₁₂₋₁₄ethoxylated)、プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated propoxylated)、1-Dodecanaminium、N-(carboxymethyl) N,N dimethyl、inner saltと1-Tetradecanaminium、N-(carboxymethyl) N,N dimethyl、inner saltグリセリン(glycerine)及び水の混合物、プロピレンオキシドエチレンオキシドポリマーオクチルエーテル(Propylene oxide ethylene oxide polymer octyl ether)、有機シリコンエトキシレート系(Organo silicone ethoxylates)、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー(Polyoxyethylene Polyoxypropylene block copolymer)、ポリオキシエチレンアルキルエーテル系(Polyoxyethylene alkyl ether)、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル系(Polyoxyethylene polyoxypropylene alkylether系)、脂肪アミンエトキシレート系(Fatty amine ethoxylates)、モノ(2-プロピルヘプチル)エーテル系オキシランメチルオキシランポリマー(Oxirane、methyl、polymer with oxirane、mono(2-propylheptyl) ether)、4級アンモニウム塩(Quaternary ammonium salt)、ナトリウムアルキルスルホサクシネート系(Sodium alkyl sulfosuccinate)、ポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル系(Polyoxyethylene sorbitan alkylester)、メチル化大豆油(Methylated soybean oil)化合物、エチル及びメチルエステルカノーラ油(Ethyl and Methyl esters of Canola Oil)、作物油濃縮物(Crop Oil Concentrate)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

20

30

40

【0012】

本発明の一具現例において、前記ピリミジンジオン系化合物は、ブタフェナシル、サフルフェナシル、チアフェナシル、ベンズフェディゾン、フルミオキサジン及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0013】

本発明の一具現例において、前記除草活性化合物をグリホサート及びグルホシネートからなる群から選択される一つ以上をさらに含むことができる。

【0014】

本発明の一具現例において、前記除草剤組成物は、界面活性剤、溶剤、消泡剤、凍結防止

50

剤、増粘剤、増量剤、pH調節剤または防腐剤をさらに含むことができる。

【0015】

本発明の一具現例において、前記界面活性剤は、エトキシ化ひまし油 (Castor oil、ethoxylates)、ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル (Polyoxyethylene Tristyrylphenyl Ether)、エトキシ化脂肪族アルコール (Ethoxylated Fatty alcohol)、エトキシ化アルキルフェノール (Alkylphenol ethoxylates)、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 (EO/PO Block copolymer)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びエトキシ化ひまし油のブレンド (Blend of Dodecylbenzenesulfonic acid、calcium salt and Castor oil ethoxylate s)、ポリエチレン ポリプロピレングリコール、モノブチルエーテル (Polyethylene polypropylene glycol、monobutyl ether)、エトキシ化されたC₁₂₋₁₅アルコール (Alcohols、C₁₂₋₁₅、ethoxylated)、メチルメタクリレート メタクリル酸 モノメトキシポリエチレングリコールメタクリレート共重合体 (Methyl methacrylate methacrylic acid monomethoxypolyethylene glycol methacrylate copolymer)、ポリオキシアルキレンアミン誘導体 (Polyoxyalkylene amine derivative)、ポリオキシエチレントリスチリルフェノールフォスフェートカリウム塩 (Polyoxyethylene tristyrylphenol phosphate、potassium salt)、ポリ(オキシエチレン)トリスチリルフェニルエーテル&トリエタノールアミン化合物 (Triethanolamine、compd. With poly(oxyethylene)tristyrylphenyl ether)、メタクリル酸 メチルメタクリレート ポリエチレングリコールメチルエーテルメタクリレート共重合体 (Methacrylic acid methyl methacrylate polyethylene glycol methyl ether methacrylate copolymer)、ナフタレンスルホン酸ホルムアルデヒドとの重合体ナトリウム塩 (Naphthalenesulfonic acid、polymer with formaldehyde、sodium salt)、ノニルフェノールエトキシ化された硫酸含有モノエーテルナトリウム塩 (Nonylphenol、ethoxylated、monoether with sulfuric acid、sodium salt)、ナトリウムビス(2-エチルヘキシル)スルホサクシネート (Sodium bis(2-ethylhexyl)sulfosuccinate)、ポリオキシエチレン ポリオキシプロピレン共重合体 (Polyoxyethylene polyoxypropylene copolymer)、2-エチルヘキシル D-グルコピラノシド ([alpha] D glucopyranoside、2-ethylhexyl)、フェノールスルホン酸ホルムアルデヒドフェノールウレア重合体ナトリウム塩 (Phenolsulfonic acid formaldehyde phenol urea polymer sodium salt)、ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム塩 (Diisobutyl naphthalenesulfonic acid、sodium salt)、ショ糖モノラウレート (Sucrose mono laurate)、ポリ(オキシ-1,2-エタンジイル)、トリス(1-フェニルエチル)フェニル ヒドロキシ フォスフェートカリウム塩 (Poly(oxy-1,2-ethanediyl)、alpha tris(1-phenylethyl)phenyl omega hydroxy phosphate、potassium salt)、ポリアミノアミドアルコキシ化縮合物 (Polyaminoamide alkoxylated condensates)、ポリエトキシ化トリスチリル及びジスチリルフェノールのリン酸エステル (Phosphoric acid esters of polyethoxylated tristyryl and distyryl

10

20

30

40

50

phenol)、2 プロペン酸、2 メチル 、ブチル2 プロペノエート及びエチニルベンゼンを有する重合体、ナトリウム塩(2 Propenoic acid、2 methyl 、polymer with butyl 2 propenoate and ethenylbenzene、sodium salt)、スルホン酸C₁₄ 16 アルカンヒドロキシ及びC₁₄ 16 アルケン、ナトリウム塩(Sulfonic acids、C₁₄ 16 alkane hydroxy and C₁₄ 16 alkene、sodium salts)、リグノスルホン酸、ナトリウム塩(Ligno sulfonic acid、sodium salt)、二ナトリウム塩硫酸(Sulfuric acid、disodium salt)、ナトリウム塩アクリル酸重合体(Acrylic acid polymer、sodium salt)、ナトリウム塩ドデシルスルフェート(Dodecyl sulfate、sodium salt)、ウレアホルムアルデヒド樹脂(Urea formaldehyde resin)、ポリエチレングリコールモノ(トリスチリルフェニル)エーテル(Polyethylene glycol mono(tristyrylphenyl) ether)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩(Dodecyl benzenesulfonic acid、calcium salt)、ナトリウムステアレート(Sodium stearate)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

10

【0016】

本発明の一具現例において、前記溶剤は、ガンマブチロラクトン(Gamma butyrolactone)、N,N ジメチルデカンアミド(N,N Dimethyl Decanamide)、ジメチルスルホキシド(Dimethyl sulfoxide)、安息香酸ブチル(Butyl benzoate)、マレイン酸2-エチルヘキシル(2 Ethylhexyl Maleate)、2 エチルヘキシルアルコール(2 Ethylhexyl Alcohol)、プロピレンカーボネート(Propylene carbonate)、ソルベントナフサ高沸点芳香族(Solvent Naphtha(petroleum)、heavy aromatic)、シクロヘキサノン(Cyclohexanone)、プロピレングリコール環状炭酸塩(Propylene glycol cyclic carbonate)、アセトフェノン(Acetophenone)、2 エチルヘキシルアセテート(2 Ethylhexyl acetate)、エチルエステル乳酸(Lactic acid、ethyl ester)、アクリル酸テトラヒドロフルフリル(Tetrahydrofurfuryl acrylate)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

20

30

【0017】

本発明の一具現例において、前記消泡剤は、ジメチルシリコン及びシロキサン(Silicones and siloxanes、dimethyl)、シロキサン及びシリコン、シリカとジメチル反応生成物(Siloxanes and Silicones、di Me reaction products with silica)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0018】

本発明の一具現例において、前記増粘剤は、スメクタイト系無機質(Smectite group minerals)、二酸化珪素(Silicon dioxide)、酸化マグネシウム(Magnesium oxide)、フラー土(Fuller's earth)、キサンタンガム(Xanthan gum)、カルボキシメチルセルロース(Carboxymethyl cellulose)、2 ヒドロキシエチルエーテルセルロース(Cellulose、2 hydroxyethyl ether)、アラビアガム(Gum Arabic)、アクリル酸重合体(Acrylic acid polymer)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

40

【0019】

本発明の一具現例において、前記増量剤は、塩化カリウム(Potassium chloride)、フラックス か焼された珪藻土(Diatomaceous earth

50

、flux calcined)、か焼された珪藻土(Diatomaceous earth、calcined)、カオリン(Kaoline)、ベントナイト(Bentonite)、尿素(Urea)、滑石(Talc)、珪藻土(1%未満の結晶質シリカ)(Diatomaceous earth(less than 1% crystalline silica))、用水(Water)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0020】

本発明の一具現例において、前記pH調節剤は、水酸化ナトリウム(Sodium hydroxide)、水酸化カリウム(Potassium hydroxide)、リン酸(Phosphoric acid)、クエン酸(Citric acid)、EDTA acid(EDTA 酸)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

10

【0021】

本発明の一具現例において、前記凍結防止剤は、プロピレングリコール(Propylene glycol)、エチレングリコール(Ethylene glycol)、グリセリン(Glycerine)、2,3-ブタンジオール(2,3-butanediol)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0022】

本発明の一具現例において、前記防腐剤は、5-クロロ-2-メチル-3-(2H)-イソチアゾロン(3-(2H)-Isothiazolone、5-chloro-2-methyl)、2-メチル-3-(2H)-イソチアゾロン(3-(2H)-Isothiazolone、2-methyl)、1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(1,2-Benzisothiazolin-3-one)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

20

【0023】

本発明の一具現例において、組成物全体100重量%を基準にして、前記薬効増進剤は3重量%ないし20重量%含まれることができる。

【0024】

本発明の一具現例において、前記除草用組成物が水和剤、乳剤、乳濁剤、微濁液、液剤、分散性液剤、顆粒水和剤、または液状水和剤であることを特徴とすることができる。

30

【0025】

本発明の一具現例において、除草剤組成物は、チアフェナシルを含む除草活性化合物；及び組成物全体100重量%を基準にして、14重量%ないし20重量%のエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols、C₁₂₋₁₄ethoxylated)またはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated propoxylated)を含む薬効増進剤を含むことができる。

【0026】

本発明の一具現例において、除草剤組成物はチアフェナシル及びグルホシネートを含む除草活性化合物；及び組成物全体100重量%を基準にして、3重量%ないし7重量%のエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols、C₁₂₋₁₄ethoxylated)またはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated propoxylated)を含む薬効増進剤を含むことができる。

40

【0027】

本発明の一具現例において、除草剤組成物は、チアフェナシル及びグリホサートを含む除草活性化合物；及び組成物全体100重量%を基準にして3重量%ないし7重量%の薬効増進剤を含み、前記薬効増進剤は、1-Dodecanaminium、N-(carboxymethyl)-N,N-dimethyl-inner salt、1-Tetradecanaminium、N-(carboxymethyl)-N,N-di

50

methyl、inner salt、Glycerine及び水の混合物を含むことができる。

【0028】

本発明は、ピリミジンジオン系化合物を含む除草活性化合物、及び前記除草活性化合物に対する薬効増進剤を含む除草剤組成物を提供する。

【0029】

本発明におけるピリミジンジオン系化合物は活性成分にあたる物質であって、植物内のプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ (protoporphyrinogen oxidase) 酵素作用を抑制して除草活性を示す物質の中で頭部 (Head part) にピリミジンジオン構造を有する化合物の系列を意味する。プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ (protoporphyrinogen oxidase) 抑制剤は、化合物の構造的類似性に応じて、大きくジフェニル エーテル (Diphenyl ether) 系列、フェニルピラゾール (Phenylpyrazoles) 系列、N フェニルフタルイミド (N phenylphthalimides) 系列、チアジアゾール (Thiadiazoles) 系列、オキサジアゾール (Oxadiazoles) 系列、トリアゾリノン (Triazolinones) 系列、オキサゾリジンジオン (Oxizolidinediones) 系列、及びピリミジンジオン (Pyrimimdinones) 系列などに分類することができる。具体的に、ジフェニル エーテル系化合物では、ホメサフェン、オキシフルオルフェン、アクロニフェン、アシフルオルフェン、ピフェノックス、エトキシフェン及びラクトフェンなどがあり、フェニルピラゾール系化合物では、ピラフルフェン エチル、N フェニルフタルイミド系化合物では、フルミオキサジン、シニドン エチル及びフルミクロラック ペンチル、チアジアゾール系化合物では、フルチアセットがある。オキサジアゾール系化合物の代表的な例として、オキサジアルギル及びオキサジアゾンがあり、トリゾリノン系化合物としてカルフェントラゾン及びスルフェントラゾン、オキシゾリジンジオン系化合物ではペントキサゾンがある。

【0030】

本発明のピリミジンジオン系化合物は、ブタフェナシル、サフルフェナシル、チアフェナシル、ベンズフェディゾン、フルミオキサジン及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0031】

また、本発明の除草活性化合物としてピリミジンジオン系化合物の他にグリホサートまたはグルホシネートをさらに含むことができる。

【0032】

本発明における薬効増進剤は、活性成分であるピリミジンジオン系化合物を雑草の作用点に容易に浸透させてピリミジンジオン系化合物の効能を増進するために除草剤組成物に含まれることができる、ピリミジンジオン系化合物ではない任意の物質を意味する。

【0033】

前記薬効増進剤は、エトキシレート系 C₁₂₋₁₄ アルコール (Alcohols、C₁₂₋₁₄ ethoxylated)、プロポキシレート系 C₉₋₁₁ アルコールエトキシレート (Alcohols C₉₋₁₁ ethoxylated propoxylated)、1 Dodecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner saltと1 Tetradecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、グリセリン (glycerine) 及び水の混合物、プロピレンオキシドエチレンオキシドポリマーオクチルエーテル (Propylene oxide ethylene oxide polymer octyl ether)、有機シリコーンエトキシレート系 (Organosilicone ethoxylates)、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー (Polyoxyethylene Polyoxypropylene block copolymer)、ポリオキシエチレンアルキルエーテル系 (Polyoxyethylene alkyl ether)、ポリ

オキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル系 (Polyoxyethylene polyoxypropylene alkylether 系)、脂肪アミンエトキシレート系 (Fatty amine ethoxylates)、モノ(2-プロピルヘプチル)エーテル系オキシランメチルオキシランポリマー (Oxirane、methyl、polymer with oxirane、mono(2-propylheptyl) ether)、4級アンモニウム塩 (Quaternary ammonium salt)、ナトリウムアルキルスルホサクシネート系 (Sodium alkyl sulfosuccinate)、ポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル系 (Polyoxyethylene sorbitan alkylester) 化合物、メチル化大豆油 (Methylated soybean oil) 化合物、エチル及びメチルエステルカノーラ油 (Ethyl and Methyl esters of Canola Oil)、作物油濃縮物 (Crop Oil Concentrate) 及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

10

【0034】

本発明の薬効増進剤は、組成物全体 100 重量%を基準にして、3 重量%ないし 20 重量%含まれることができる。

【0035】

一方、本発明の除草剤組成物は界面活性剤及び溶剤をさらに含むことができる。

【0036】

前記界面活性剤は、エトキシル化ひまし油 (Castor oil、ethoxylates)、ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル (Polyoxyethylene Tristyrylphenyl Ether)、エトキシル化脂肪族アルコール (Ethoxylated Fatty alcohol)、エトキシル化アルキルフェノール (Alkylphenol ethoxylates)、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 (EO/PO Block copolymer)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びエトキシル化ひまし油のブレンド (Blend of Dodecylbenzenesulfonic acid、calcium salt and Castor oil ethoxylates)、ポリエチレン ポリプロピレングリコール、モノブチルエーテル (Polyethylene polypropylene glycol、monobutyl ether)、エトキシル化された C12-15 アルコール (Alcohols、C12-15、ethoxylated)、メチルメタクリレート-メタクリル酸-モノメトキシポリエチレングリコールメタクリレート共重合体 (Methyl methacrylate methacrylic acid monomethoxypolyethylene glycol methacrylate copolymer)、ポリオキシアルキレンアミン誘導体 (Polyoxyalkylene amine derivative)、ポリオキシエチレントリスチリルフェノールフォスフェートカリウム塩 (Polyoxyethylene tristyrylphenol phosphate、potassium salt)、ポリ(オキシエチレン)トリスチリルフェニルエーテル&トリエタノールアミン化合物 (Triethanolamine、compd. With poly(oxyethylene) tristyrylphenyl ether)、メタクリル酸-メチルメタクリレート-ポリエチレングリコールメチルエーテルメタクリレート共重合体 (Methacrylic acid methyl methacrylate polyethylene glycol methyl ether methacrylate copolymer)、ナフタレンスルホン酸ホルムアルデヒドとの重合体、ナトリウム塩 (Naphthalenesulfonic acid、polymer with formaldehyde、sodium salt)、ノニルフェノールエトキシル化された硫酸含有モノエーテル、ナトリウム塩 (Nonylphenol、ethoxylated、monoether with sulfuric acid、sodium salt)、ナトリウムビス(2-エチルヘキシル)スルホサクシネート (Sodium bis(2-

20

30

40

50

ethylhexyl)sulfosuccinate)、ポリオキシエチレン ポリオキシプロピレン共重合体(Polyoxyethylene polyoxypropylene copolymer)、2 エチルヘキシル D グルコピラノシド([alpha] D glucopyranoside、2 ethylhexyl)、フェノールスルホン酸ホルムアルデヒドフェノールウレア重合体、ナトリウム塩(Phenolsulfonic acid formaldehyde phenol urea polymer、sodium salt)、ジイソブチルナフタレンスルホン酸、ナトリウム塩(Diisobutylnaphthalenesulfonic acid、sodium salt)、ショ糖モノラウレート(Sucrose monolaurate)、ポリ(オキシ 1, 2 エタンジイル)、 トリス(1 フェニルエチル)フェニル ヒドロキシ フォスフェートカリウム塩(Poly(oxy 1, 2 ethanediyl)、alpha tris(1 phenylethyl)phenyl omega hydroxy phosphate、potassium salt)、ポリアミノアミドアルコキシ化縮合物(Polyaminoamide alkoxylated condensates)、ポリエトキシ化トリスチリル及びジスチリルフェノールのリン酸エステル(Phosphoric acid esters of polyethoxylated tristyryl and distyrylphenol)、2 プロペン酸、2 メチル 、ブチル 2 プロペノエート及びエチルベンゼンを有する重合体、ナトリウム塩(2 Propenoic acid、2 methyl 、polymer with butyl 2 propenoate and ethenylbenzene、sodium salt)、スルホン酸C14 16 アルカンヒドロキシ及びC14 16 アルケン、ナトリウム塩(Sulfonic acids、C14 16 alkane hydroxy and C14 16 alkene、sodium salts)、リグノスルホン酸、ナトリウム塩(Lignosulfonic acid、sodium salt)、二ナトリウム塩硫酸(Sulfuric acid、disodium salt)、ナトリウム塩アクリル酸重合体(Acrylic acid polymer、sodium salt)、ナトリウム塩ドデシルスルフェート(Dodecyl sulfate、sodium salt)、ウレア ホルムアルデヒド樹脂(Urea formaldehyde resin)、ポリエチレングリコールモノ(トリスチリルフェニル)エーテル(Polyethylene glycol mono(tristyrylphenyl)ether)、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩(Dodecylbenzenesulfonic acid、calcium salt)、ナトリウムステアレート(Sodium stearate)及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0037】

前記溶剤は、ガンマブチロラクトン(Gamma butyrolactone)、N, N ジメチルデカンアミド(N, N Dimethyl Decanamide)、ジメチルスルホキシド(Dimethyl sulfoxide)、安息香酸ブチル(Butyl benzoate)、マレイン酸 2-エチルヘキシル(2 Ethylhexyl Maleate)、2 エチルヘキシルアルコール(2 Ethylhexyl Alcohol)、プロピレンカーボネート(Propylene carbonate)、ソルベントナフサ高沸点芳香族(Solvent Naphtha(petroleum)、heavy aromatic)、シクロヘキサノン(Cyclohexanone)、プロピレングリコール環状炭酸塩(Propylene glycol cyclic carbonate)、アセトフェノン(Acetophenone)、2 エチルヘキシルアセテート(2 Ethylhexyl acetate)、エチルエステル乳酸(Lactic acid、ethyl ester)、アクリル酸テトラヒドロフルフリル(Tetrahydrofurfuryl acrylate)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0038】

10

20

30

40

50

本発明の一具現例において、前記消泡剤は、ジメチルシリコン及びシロキサン (Silicones and siloxanes、dimethyl)、シロキサン及びシリコン、シリカとジメチル反応生成物 (Siloxanes and Silicones、di M e reaction products with silica)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0039】

本発明の一具現例において、前記増粘剤は、スメクタイト系無機質 (Sme ct it e group minerals)、二酸化珪素 (Silicon dioxide)、酸化マグネシウム (Magnesium oxide)、フラー土 (Fuller's ea r th)、キサンタンガム (Xanthan gum)、カルボキシメチルセルロース (Carboxymethyl cellulose)、2 ヒドロキシエチルエーテルセルロース (Cellulose、2 hydroxyethyl ether)、アラビアガム (Gum Arabic)、アクリル酸重合体 (Acrylic acid polymer)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

10

【0040】

本発明の一具現例において、前記増量剤は、塩化カリウム (Potassium chl or ide)、フラックス か焼された珪藻土 (Diatomaceous ea r th、flux calcined)、か焼された珪藻土 (Diatomaceous ea r th、calcined)、カオリン (Kaoline)、ベントナイト (Bento n ite)、尿素 (Urea)、滑石 (Talc)、珪藻土 (1%未満の結晶質シリカ) (Diatomaceous ea r th (less than 1% crystalline silica))、用水 (Water)、及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

20

【0041】

本発明の一具現例において、前記pH調節剤は、水酸化ナトリウム (Sodium hy droxide)、水酸化カリウム (Potassium hydroxide)、リン酸 (Phosphoric acid)、クエン酸 (Citric acid)、EDTA acid (EDTA 酸) 及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

【0042】

本発明の一具現例において、前記凍結防止剤は、プロピレングリコール (Propyle ne glycol)、エチレングリコール (Ethylene glycol)、グリセリン (Glycerine)、2,3 ブタンジオール (2,3 butanediol) 及びこれらの組み合わせからなる群から選択されることができる。

30

【0043】

本発明の一具現例において、前記防腐剤は、5 クロロ 2 メチル3 (2H) イソチアゾロン (3 (2H) Isothiazolone、5 chloro 2 meth y l)、2 メチル3 (2H) イソチアゾロン (3 (2H) Isothiazolo ne、2 meth y l)、1,2 ベンズイソチアゾリン 3 オン (1,2 Ben z isothiazolin 3 one)、及びこれらの組み合わせからなる群から選 択されることができる。

40

【0044】

本発明は、前記ピリミジンジオン系化合物、薬効増進剤及び界面活性剤を含むマイクロエマルジョン剤形、液状水和剤形、顆粒水和剤形の除草剤組成物を提供することができる。

【0045】

マイクロエマルジョンは、水、オイル、界面活性剤の混合系として等方性を有し、熱力学的に安定した液体混合物である。オイル成分がO/W (oil in water) または W/O (water in oil) 形態の膨張ミセル形態で存在するため、処方設計によって薬効増進剤を入れながら物理的に安定した混合組成物を確保することができる。また、分散粒剤の大きさが微小で、表面張力が極めて低い透明な液状剤形であるため、浸透移

50

行性に優れて生物学的活性を最適化するシナジー効果を期待することができる。

【0046】

本発明によるマイクロエマルジョン剤形は、接触性薬剤であるピリミジンジオン系化合物の生物効果発現特性を高めることができ、展着能力と浸透力が向上され、広葉雑草はもちろん細葉雑草に対しても速効性を向上させることができ、他の除草剤に抵抗性を表す雑草に対しても低い薬量で効果的な防除が可能である。また、熱力学的安定性を有して貯蔵安定性を高め、活性成分であるピリミジンジオン系化合物が均一に分散されているので、薬剤を処理する時に均一で優れる薬効をあらわすことができる。

【0047】

また、本発明は、前記除草剤組成物を約20ないし約30で攪拌する段階を含むマイクロエマルジョンの製造方法を提供する。具体的に、前記組成物はピリミジンジオン系化合物、薬効増進剤、界面活性剤及び溶剤を含み、必要に応じてさらに精製水を含むことができる。このような製造方法は、別途加温工程や強い攪拌がなくてもマイクロエマルジョン剤形を製造することができ、少ない維持費で製造可能なので工程の大型化にも有利である。好ましくは、前記攪拌は約300ないし約500rpmの速度で約10分ないし約30分間行われる。

【0048】

液状水和剤は、水などの水溶性溶媒または鉱物油のような非水溶性溶媒に固相の農薬原剤を分散させた剤形であって、水に希釈すれば農薬原剤は分散されるので、懸濁剤ともいう。一般に、有効成分、界面活性剤、増粘剤、凍結防止剤などを適切な割合で混合し、生物学的活性効果を増進するために薬効増進剤をさらに仕入可能である。

【0049】

撒布のために希釈する時、開封及び坪量中の飛散及び匂いの問題が少ないので、取り扱い上の利点が高くて農民が最も好む剤形のの一つとして選ばれている。

【0050】

本発明による液状水和剤は、水に有効成分であるピリミジンジオン系化合物を微細なパーティクル形態で懸濁させたWater base剤形で有機溶媒を使わないので環境にやさしい剤形で、匂い及び刺激性の少ない特徴がある。また、グリホサートまたはグルホシネート合剤の組み合わせによって薬効のシナジー効果を期待することができる。

【0051】

また、酸度調節剤などを活用してピリミジンジオン系化合物の加水分解反応を低減させ、熱力学的安定性を保有して貯蔵安定性を高め、活性成分であるピリミジンジオン系化合物が均一に分散されているので、薬剤処理の時に均一で優れる薬効をあらわすことができる。

【0052】

また、本発明は、前記液状水和剤の製造方法を提供する。具体的に、前記組成物はピリミジンジオン系化合物、グリホサート化合物、グルホシネート化合物、薬効増進剤、界面活性剤、酸度調節剤、増粘剤、防腐剤、凍結防止剤及び精製水を含む。このような製造方法は、有効成分、界面活性剤、酸度調節剤、増粘剤及び精製水を含む湿式粉碎工程、増粘剤、防腐剤及び精製水を含む増粘剤製造工程、グリホサート化合物、グルホシネート化合物及び薬効増進剤攪拌工程、各工程別に行った後、これを混合して製品を生産することができる。

【0053】

顆粒水和剤は、水に投入した後で攪拌した時、粒子が速かに崩壊された後固相の微粒子で分散される顆粒形態の製剤をいい、固相の有効成分と界面活性剤、増量剤などを乾式微粉砕した後、ねり及び組み立てによって生成する顆粒状製剤をいう。本剤形は原剤の含量を最も高めることができ、小包み可能で物流費用を最小化することができるので、高含量の顆粒水和剤の場合、輸出用で活用価値が高い品目である。また、Tank mix adjuvantの混用組み合わせを通じて生物学的効果増進を最適化することができる。

【0054】

本発明による顆粒水和剤剤形は、接触性薬剤であるピリミジンジオン系化合物の高含量剤

10

20

30

40

50

形が可能で、Tank mix adjuvantとの混用組み合わせを通じて展着能力と浸透力が向上され、広葉雑草はもちろん細葉雑草に対しても速効性と持続性に優れ、既存の除草剤に抵抗性をあらわす雑草に対しても低い薬量で効果的な防除価を示す。

【0055】

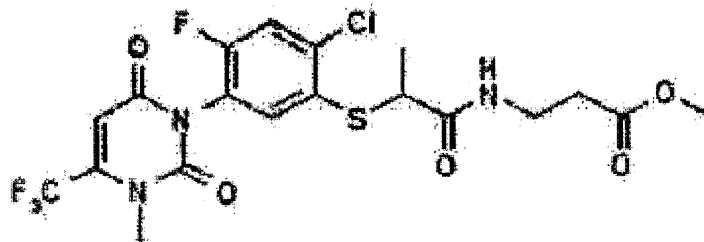
また、本発明は前記顆粒水和剤の製造方法を提供する。具体的に、前記組成物はピリミジンジオン系化合物、界面活性剤、酸度調節剤、及び増量剤を含む。このような製造方法は、有効成分、界面活性剤、酸度調節剤、及び増量剤を含むハンマーミルまたはエアーミルの粉碎工程、精製水を含んで練った後、ペレットリングする組み立て工程、流動層乾燥器を通じる乾燥工程、各工程別に連続的に行った後、最終品を選別して製品を生産することができる。

10

【0056】

本発明の一具現例において、ピリミジンジオン系化合物はチアフェナシルである。チアフェナシルは、3-[(2-[2-クロロ-5-(3,6-ジヒドロ-3-メチル-2,6-ジオキソ-4-トリフルオロメチル-1(2H)-ピリミジニル)-4-フルオロフェニルチオ]-1-沃素プロピル}アミノ]プロパン酸メチルエステルとして、下記化学式(I)で表す：

【化1】



化学式 (I)

20

【0057】

チアフェナシルは、既存の非選択性除草剤であるパラコートに比べて毒性が低く、発生した抵抗性雑草がないピリミジンジオン系化合物である。

30

【0058】

本発明の一具現例において、薬効増進剤は、エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール(Alcohols, C₁₂₋₁₄ethoxylated)またはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート(Alcohols C₉₋₁₁ethoxylated propoxylated)である。エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールは12個ないし14個の炭素数を有する線形2次アルコールにエチレンオキシドが加えられた非イオン性界面活性剤であって、優れる湿潤力と低い表面張力、高い溶解度を通じて浸透力を高める増進剤として好ましい。プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートは、エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールと類似の薬効増進効果を有しながらも眼球への刺激性が低くて好ましい。

40

【0059】

本発明の一具現例において、チアフェナシル丹剤に対する薬効増進剤としてエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールまたはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートが組成物全体100重量%を基準にして、14重量%ないし20重量%含有されてもよい。

【0060】

本発明の一具現例において、チアフェナシル及びグルホシネート合剤に対する薬効増進剤としてエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールまたはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートが組成物全体100重量%を基準にして3重量%ないし7重量%

50

含有されてもよい。

【0061】

本発明の一具現例において、チアフェナシル及びグリホサート合剤に対する薬効増進剤として1 Dodecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、1 Tetradecanaminium、N (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、Glycerine及びWaterを含む混合物が組成物全体100重量%を基準にして3重量%ないし7重量%含有されてもよい。

【0062】

それによって、本発明は、このような除草剤組成物を雑草、これの種子またはこれの生殖地に適用する段階を含む、雑草を防除する方法を提供する。

10

【0063】

本発明の一具現例において、雑草は広葉雑草及び細葉雑草であってもよく、細葉雑草はイネ科雑草及びカヤツリグサ科の雑草であってもよい。広葉雑草は、タカサプロウ、メナモミ、トキンソウ、ヨモギ、アメリカセンダングサ、セイヨウタンポポ、ハキダメギク、キツネアザミ、ヤブタビラコ、コメナモミ、オオブタクサ、苦菜、イヌヤクシソウ、アキノノゲシ、アレジアザミ、タンポポ、豚草、エノキグサ、アゼナ、イヌホオズキ、ルコウソウ、昼顔、イヌビユ、アオゲイトウ、細青鶏頭、イチビ、カナムグラ、スベリヒユ、ツユクサ、ガガイモ、スミレ、タビラコ、オオバコ、クサネム及びオナモミ、ナズナ、イヌナズナ、ヤエムグラ、オランダミミナグサ、スカシタゴボウ、ヒメジョオン、ヒメムカシヨモギ、クサノオウ、ホトケノザ、ハコベ、アカザ、ヤハズエンドウ、オキノゲシ、タチイヌノフグリ、オオイヌタデ、ザクロソウ、ウシハコベ、ギシギシ、クローバ、ケカナダアキノキリンソウを含み、これに制限されない。イネ科雑草は、メヒシバ、カモジグサ、ヒエグサ、オオクサキビ、オヒシバ、エノコログサ、アキノエノコログサ、イチゴツナギ、ケンタッキーフールグラス、キビ、スズメノテツボウ、Eriochloa gracilis、チガヤ、Dallis grassを含み、これに制限されない。カヤツリグサ科雑草は、タマガヤツリ、コゴメガヤツリを含み、これに制限されない。その他雑草は、難防除雑草で有名なスギナを含み、これに制限されない。すなわち、本発明の除草剤組成物は様々な雑草に全て適用可能である。

20

【0064】

本発明の一具現例において、除草剤組成物は約200ないし約1500L/haの撒布物量で適用されることができる。好ましくは、撒布ノズル及び機器によって国内では約1000L/ha、アメリカ及びヨーロッパでは約200L/haの撒布物量で適用され、低い撒布物量でも高い生物活性を達成して効果的に雑草を防除できるようにする。

30

【0065】

以下、本発明の構成要素と技術的特徴を次の実施例を通じてより詳細に説明する。しかし、下記実施例は本発明の内容を例示するものに過ぎず、発明の範囲が実施例によって限定されるものではない。

【実施例】

【0066】

実施例1：チアフェナシル活性成分及び薬効増進剤を含むサンプルの表面張力及び防除価
本発明者らは、ピリミジンジオン系の代表的な化合物の一つであるチアフェナシルを活性成分にして以下の実験を行って結果を導き出した。チアフェナシルである3 [{ 2 [2 クロロ 5 (3 , 6 ジヒドロ 3 メチル 2 , 6 ジオキソ 4 トリフルオロメチル 1 (2 H) ピリミジニル) 4 フルオロフェニルチオ] 1 沃素プロピル } アミノ] プロパン酸メチルエステル (ファームハンノン) を活性成分とするが ; 有機シリコーンエトキシレート系化合物として3種の物質、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー物質、ポリオキシエチレンアルキルエーテル系化合物として2種の物質、エトキシレート系C₁₂ 14アルコール、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンアルキルエーテル系化合物、プロボキシレート系C₉ 11アルコールエトキ

40

50

シレート化合物、脂肪アミンエトキシレート系化合物として4種の物質、モノ(2-プロピルヘプチル)エーテル系オキシランメチルオキシランポリマー、4級アンモニウム塩化合物、ナトリウムアルキルスルホサクシネート系化合物及びポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル系化合物総17種の薬効増進剤を用意した。

【0067】

活性成分チアフェナシルの生物効果を増進することができる薬効増進剤組成物を選抜するために、活性成分チアフェナシル0.2mgをアセトン33.3mlに溶解した後で水66.6mlと混合し、これに各薬効増進剤別に50μlずつ混合した後、この混合液を1000L/haの撒布物量でスプレースで雑草に薬剤を処理した。

【0068】

ピリミジンジオン系列の除草剤は、大体広葉雑草に効果が優秀であるが、イネ科雑草には相対的に効果が足りない傾向がある。よって、実施例1では、イネ科雑草の中で、表面に毛が多くて防除がよくできないメヒシバを対象雑草にして、メヒシバが4葉期の時処理して試験を行った。薬効は、処理後7日目に%防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば、防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

【0069】

また、各薬効増進剤の表面張力低下能力を測定するために、表面張力計Wet 6000(RHESCA)を使って温度23.5、湿度19%の条件で、長さ24mm、厚さ1mmのプラチナ錘を利用して各表面張力を測定した。測定された%防除価及び表面張力は下記表1のように示す。

【0070】

【表1】

表1 薬効増進剤別表面張力及び防除価(温室試験)

サンプル	薬効増進剤	純度(%)	評価	
			表面張力(Dyne/cm)	防除価(%)
1	対照試料(薬効増進剤無添加)	-	39.39	10
2	有機シリコーンエトキシレート系化合物#1	100	28.74	70
3	有機シリコーンエトキシレート系化合物#2	100	27.48	77.5
4	有機シリコーンエトキシレート系化合物#3	100	31.44	72.5
5	ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー	100	36.55	50
6	ポリオキシエチレンアルキルエーテル系化合物#1	100	30.12	70
7	ポリオキシエチレンアルキルエーテル系化合物#2	100	29.22	65
8	エトキシレート系C12-14アルコール	100	29.57	90
9	ポリオキシエチレンアルキルエーテル系化合物	100	32.34	55
10	プロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレート化合物	100	30.47	80
11	脂肪アミンエトキシレート系化合物#1	100	26.67	77.5
12	脂肪アミンエトキシレート系化合物#2	100	30.37	65
13	脂肪アミンエトキシレート系化合物#3	-	32.96	75
14	脂肪アミンエトキシレート系化合物#4	100	33.9	77.5
15	モノ(2-プロピルヘプチル)エーテル系オキシランメチルオキシランポリマー	100	33.69	75
16	4級アンモニウム塩化合物	90	22.17	62.5
17	ナトリウムアルキルスルホサクシネート系化合物	90	20.51	62.5
18	ポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル系化合物	100	29.43	68.3

【0071】

表 1 で示すように、実験した大概の薬効増進剤から高い防除価 % を確認することができた。特に、エトキシレート系 C 1 2 1 4 アルコールが薬効増進剤で使われた場合、最も高い % 防除価を示した。すなわち、エトキシレート系 C 1 2 1 4 アルコールは、メヒシバ葉の表面に毛が多くて、よく展着されない条件であるにもかかわらず、完璧な展着効果を示し、接触性のピリミジンジオン系薬剤の弱点である浸透 / 移行力を向上させ、より速い速効性と薬効増進効果を示すことであらわれた。

【 0 0 7 2 】

一方、表面張力が低すぎると、薬剤処理後に薬剤が横から流れ落ちて、高すぎると薬液が滴になって均一に拡張されない特性があって、適正水準の表面張力を保有するのが必要である。前記防除価測定結果に基づいてチアフェナシルの生物活性を増進することができる薬効増進剤としてエトキシレート系 C 1 2 1 4 アルコールが最も優れることを確認した。

10

【 0 0 7 3 】

実施例 2：薬効増進剤仕入量による防除価

薬効増進剤をエトキシレート系 C 1 2 1 4 アルコールまたはプロポキシレート系 C 9 1 1 アルコールエトキシレートにし、実施例 1 と類似な方法で薬効増進剤仕入量決定試験を行った。活性成分 0 . 2 m g をアセトン 3 3 . 3 m l に溶解した後、水 6 6 . 6 m l と混合し、これに薬効増進剤のエトキシレート系 C 1 2 1 4 アルコールまたはプロポキシレート系 C 9 1 1 アルコールエトキシレートを各 5 8 . 8 u l (1 / 1 7 0 0 倍希釈) 、 5 0 u l (1 / 2 0 0 0 倍希釈) 、 4 1 . 1 6 u l (1 / 2 4 2 9 倍希釈) 4 0 u l (1 / 2 5 0 0 倍希釈) をそれぞれ入れて混合した後、この混合液を 1 0 0 0 L / h a の撒布物量で温室でスプレイブースによって雑草に薬剤処理した。

20

【 0 0 7 4 】

これは撒布物量 (1 0 0 0 L / h a) 対比薬効増進剤が各 1 / 1 7 0 0 倍 (2 0 重量 % 仕入) 、 1 / 2 0 0 0 倍 (1 7 重量 % 仕入) 、 1 / 2 4 2 9 倍希釈 (1 4 重量 % 仕入) 、 1 / 2 5 0 0 倍 (1 3 . 6 重量 % 仕入) 、希釈されたことに該当するところ、該当サンプルの撒布物量は 1 0 0 0 L / h a にして、対象雑草メヒシバが 4 葉期の時処理した。原剤の生物活性評価時に一般的に利用する方法のように、薬効は処理後 9 日目に % 防除価で達観評価し、測定された % 防除価は下記表 2 のように示す。達観評価方法は雑草が完全に枯死すれば防除価 1 0 0 % 、無処理は防除価 0 % で調査した。

【 0 0 7 5 】

30

40

50

【表 2】

表 2 薬効増進剤のエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール及びプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの仕入量別防除価（温室試験）

サンプル	除草活性化合物	薬効増進剤仕入量（重量%）	処理後9日目の防除価（%）
			メヒシバ（4 L S、8 cm）
1	Tiafenacil 2 g ai/ha	エトキシレート系C ₁₂₋₁₄ アルコール、20%	97
2	Tiafenacil 2 g ai/ha	エトキシレート系C ₁₂₋₁₄ アルコール、17%	92
3	Tiafenacil 2 g ai/ha	エトキシレート系C ₁₂₋₁₄ アルコール、14%	90
4	Tiafenacil 2 g ai/ha	エトキシレート系C ₁₂₋₁₄ アルコール、13.6%	79
5	Tiafenacil 2 g ai/ha	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコール エトキシレート、20%	95
6	Tiafenacil 2 g ai/ha	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコール エトキシレート、17%	91
7	Tiafenacil 2 g ai/ha	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコール エトキシレート、14%	88
8	Tiafenacil 2 g ai/ha	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコール エトキシレート、13.6%	72

【0076】

表2で示すように、薬効増進剤のエトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコール及びプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートのいずれも有効成分量が増加するほど効果も増加した。撒布物量対比1/1700倍で希釈（20重量%仕入）する時、1/2500倍で希釈（13.6重量%仕入）した場合に比べて防除価が著しく増加した。また、1/2429倍で希釈（14重量%仕入）した場合、1/2500倍で希釈（13.6重量%仕入）した場合に比べて重量%の差が大きくないにもかかわらず、防除価が多く増加することが分かる。薬効増進剤の量をもっと増やす場合、効果増進が期待されるが、薬効増進剤の仕入量を増加させるほど、眼球への刺激性が大きくなり、材料費が上昇する恐れがあるので、薬効増進剤の製品内で適正仕入率は防除価効果に優れる14重量%ないし20重量%である。

【0077】

実施例3．チアフェナシル丹剤微濁液及び薬効増進剤を含むサンプルの防除価

一方、本発明者らは、エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールと類似な薬効増進効果を示しながら眼球への刺激性が少ないプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートに対しても効果を確認した。

【0078】

活性成分であるチアフェナシル5重量%と薬効増進剤エトキシレート系C₁₂₋₁₄アルコールまたはプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートのそれぞれを14重量%仕入及び17重量%仕入で混合してME（Microemulsion、微濁液）で製造した後、この混合液を1000 L/haの撒布物量でスプレイブースで雑草に薬剤処理した。有効成分量は10 g ai/ha、20 g ai/ha及び40 g ai/haで処理した。

【0079】

前記12個のサンプルを対象雑草のヒエグサ及びヒユに処理した。薬効は処理後4、11

及び 20 日目に % 防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価 100 %、無処理は防除価 0 % で調査した。

【 0 0 8 0 】

【表 3】

表 3 ティアフエナシル丹剤微濁液の薬効増進剤エトキシレート系 C₁₂₋₁₄ アルコール及びプロボキシレート系 C₉₋₁₁ アルコールの仕入量別防除価 (温室試験)

サンプル	除草活性化化合物	薬効増進剤	有効成分量 (g a i / h a)	処理後 4、11、20 日目					
				ヒエグサ (30~35 cm)			ヒユ (25~30 cm)		
				4 D A A	11 D A A	20 D A A	4 D A A	11 D A A	20 D A A
1	Tiafena cil 5%M E	エトキシ レート系 C ₁₂₋₁₄ アルコール 17%	10	10	13	15	60	70	78
2	Tiafena cil 5%M E		20	25	25	25	80	90	97
3	Tiafena cil 5%M E		40	55	60	60	88	92	94
4	Tiafena cil 5%M E	エトキシ レート系 C ₁₂₋₁₄ アルコール 14%	10	10	30	35	50	60	75
5	Tiafena cil 5%M E		20	35	33	25	65	75	75
6	Tiafena cil 5%M E		40	60	60	55	90	99	99
7	Tiafena cil 5%M E	プロボキ シレート 系 C ₉₋₁₁ アルコール エトキシ シレート 17%	10	10	20	25	50	70	75
8	Tiafena cil 5%M E		20	25	30	30	83	90	91
9	Tiafena cil 5%M E		40	40	70	55	85	94	95
10	Tiafena cil 5%M E	プロボキ シレート 系 C ₉₋₁₁ アルコール エトキシ シレート 14%	10	10	13	15	45	75	73
11	Tiafena cil 5%M E		20	25	25	23	78	80	83
12	Tiafena cil 5%M E		40	45	73	58	83	85	85

【 0 0 8 1 】

表 3 で示すように、プロボキシレート系 C₉₋₁₁ アルコールエトキシレートは、実施例 1 を通じて最も優れる薬効増進剤で検証されたエトキシレート系 C₁₂₋₁₄ アルコールと類似な薬効増進効果を示すことで確認された。

【 0 0 8 2 】

すなわち、プロボキシレート系 C₉₋₁₁ アルコールエトキシレートに対してもチアフエ

ナシルの生物活性を増進することができる薬効増進剤であることを確認した。

【 0 0 8 3 】

薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートを17%含む試料の有効成分量が4ないし32 g a i / h a になるように温室条件で1 0 0 0 L / h a の撒布物量で栽培された下記対象雑草にそれぞれ処理し、これらの生物活性を評価した。測定されたそれぞれの生物活性は達観評価で行い、下記表4ないし表6のように示す。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

【 0 0 8 4 】

【表4】

表4 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、温室での多様な草種に対する生物活性（温室試験）

除草活性化化合物	薬効増進剤	有効成分量 (g a i / h a)	処理後15日目の防除価 (%)				
			イヌホオズキ	ルコウソウ	昼顔	アオゲイトウ	イチビ
			3 L S、5 ~ 7 c m	3 ~ 5 L S、1 8 ~ 3 5 c m	5 ~ 7 L S、5 ~ 1 0 c m	2 ~ 3 L S、5 ~ 8 c m	3 ~ 4 L S、8 ~ 1 0 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコールエトキシレート17%	4	100	100	100	100	100
		8	100	100	100	100	100
		16	100	100	100	100	100
		32	100	100	100	100	100

【 0 0 8 5 】

【表5】

表5 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、温室での多様な草種に対する生物活性（温室試験）

除草活性化化合物	薬効増進剤	有効成分量 (g a i / h a)	処理後15日目の防除価 (%)			
			クサネム	オナモミ	コゴメガヤツリ	オオクサキビ
			4 L S、1 2 ~ 1 7 c m	3 ~ 4 L S、5 ~ 9 c m	2 L S、5 ~ 9 c m	2 ~ 3 L S、4 ~ 7 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコールエトキシレート17%	4	100	100	93	55
		8	100	100	100	73
		16	100	100	100	90
		32	100	100	100	98

【 0 0 8 6 】

10

20

30

40

50

【表 6】

表6 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、温室での多様な草種に対する生物活性（温室試験）

除草活性化合物	薬効増進剤	有効成分量 (g a i / h a)	処理後15日目の防除価 (%)			
			ヒエグサ	メヒシバ	エノコログサ	キビ
			3~3.5 L S、18~25 cm	3~3.5 L S、20~23 cm	2~3 L S、14~18 cm	4~4.5 L S、40 cm
T i a f e n a c i l 5 %ME	プロポキシレート系C ₉₋₁₁ アルコールエトキシレート17%	4	75	80	100	95
		8	100	93	100	98
		16	100	100	100	100
		32	100	100	100	100

10

【0087】

表4ないし表6で示すように、本発明で製造されたマイクロエマルジョン剤形を含む除草剤組成物は、展着能力と浸透力が向上されたので、広葉雑草はもちろんイネ科雑草に対しても生物効果に優れ、低い薬量で効果的な防除が可能であることを確認することができた。製造された試料は、基本的に広葉雑草で、特に、イヌホオズキ、ルコウソウ、昼顔、アオゲイトウ、イチビ、クサネム、オナモミ、コゴメガヤツリに対して優れる防除価を示し、オオクサキビ、ヒエグサ、メヒシバ、エノコログサ、アキノエノコログサ、キビなどのイネ科雑草に対する効果も優れるという点で意義がある。

20

【0088】

薬効増進剤のプロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートを17%含む試料の有効成分量を150 g a i / h aで固定し、フィールド条件で1000 L / h aの撒布物量で下記表5の対象雑草にそれぞれ適用し、これらの生物活性を従来の除草剤であるパラコート、グルホシネート及びグリホサートを適用した場合と比較評価した。測定されたそれぞれの生物活性は達観評価で行い、下記表7ないし表14のように示す。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

30

【0089】

【表 7】

表7 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性（包装試験）

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		ナズナ	イヌナズナ	タビラコ	ヤエムグラ	ユロブゾムナドナクル
		47 cm	36 cm	15 cm	35 cm	24 cm
T i a f e n a c i l 5 %ME	150	100	100	100	100	95
パラコートジクロリド23.1%SL	1,155	100	100	-	100	100
グルホシネート-Am18%SL	900	90	100	100	100	100
グリホサート-IPA41%SL	2,050	100	100	100	100	100

40

【0090】

50

【表 8】

表 8 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性（包装試験）

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		スカシタ ゴボウ	ヒメジョ オン	ヒメムカシ ヨモギ	クサノ オウ	ホトケ ノザ
		40 c m	40 c m	40 c m	65 c m	30 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	9 9	9 5	9 5	1 0 0	1 0 0
パラコートジクロリド 23.1 % S L	1, 1 5 5	9 9	1 0 0	-	1 0 0	1 0 0
グルホシネート - A m 18 % S L	9 0 0	9 9	1 0 0	1 0 0	1 0 0	1 0 0
グリホサート - I P A 41 % S L	2, 0 5 0	1 0 0	1 0 0	-	1 0 0	1 0 0

10

【 0 0 9 1 】

【表 9】

20

表 9 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性（包装試験）

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		ハコベ	イチビ	アカザ	スベリヒ ユ	エノキグ サ
		24 c m	100 c m	75 c m	50 c m	45 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	9 7	1 0 0	9 8	9 8	1 0 0
パラコートジクロリド2 3.1 % S L	1, 1 5 5	1 0 0	9 5	1 0 0	9 4	1 0 0
グルホシネート - A m 18 % S L	9 0 0	1 0 0	8 5	9 9	9 2	7 8
グリホサート - I P A 41 % S L	2, 0 5 0	1 0 0	6 8	1 0 0	9 8	9 4

30

【 0 0 9 2 】

40

50

【表 10】

表 10 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロボキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性 (包装試験)

試料	有効成分量 (g a i /h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		タカサブ ロウ	ツユクサ	ヤハズエ ンドウ	オニノゲ シ	タチイヌ ノフグリ
		2 3 c m	4 5 c m	3 1 c m	4 3 c m	2 5 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	1 0 0	9 7	1 0 0	1 0 0	1 0 0
パラコートジクロリド2 3. 1 % S L	1, 1 5 5	1 0 0	9 7	1 0 0	1 0 0	1 0 0
グルホシネート - A m 1 8 % S L	9 0 0	1 0 0	8 8	1 0 0	1 0 0	1 0 0
グリホサート - I P A 4 1 % S L	2, 0 5 0	1 0 0	8 3	1 0 0	1 0 0	1 0 0

10

【0093】

【表 11】

表 11 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロボキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性 (包装試験)

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		細青鶏頭	オオイヌ タデ	ザクロソ ウ	ハキダメ ギク	トキンソ ウ
		4 3 c m	5 3 c m	1 3 c m	3 5 c m	7 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	9 6	1 0 0	9 8	1 0 0	1 0 0
パラコートジクロリド2 3. 1 % S L	1, 1 5 5	1 0 0	1 0 0	1 0 0	1 0 0	9 9
グルホシネート - A m 1 8 % S L	9 0 0	9 8	1 0 0	1 0 0	1 0 0	1 0 0
グリホサート - I P A 4 1 % S L	2, 0 5 0	1 0 0	1 0 0	1 0 0	1 0 0	-

20

30

【0094】

40

50

【表 1 2】

表 1 2 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性（包装試験）

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		オニタビ ラコ	ヨモギ	ウシハコ ベ	タンポポ	昼顔
		3 8 c m	5 0 c m	4 1 c m	4 0 c m	2 5 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	1 0 0	9 5	9 5	9 7	1 0 0
パラコートジクロリド 2 3 . 1 % S L	1 , 1 5 5	1 0 0	9 5	1 0 0	9 7	9 9
グルホシネート - A m 1 8 % S L	9 0 0	1 0 0	9 5	9 0	9 2	9 8
グリホサート - I P A 4 1 % S L	2 , 0 5 0	-	9 9	1 0 0	1 0 0	8 0

10

【 0 0 9 5】

【表 1 3】

表 1 3 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性（包装試験）

試料	有効成分量 (g a i / h a)	最高効果を示す時の防除価 (%)				
		ギシギシ	クローバ	ケカナダ アキノキ リンソウ	スズメノ テツボウ	ヒエグサ
		3 8 c m	2 5 c m	5 0 c m	4 2 c m	6 5 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	9 9	9 8	9 9	9 5	9 5
パラコートジクロリド 2 3 . 1 % S L	1 , 1 5 5	9 6	9 1	9 9	9 8	9 2
グルホシネート - A m 1 8 % S L	9 0 0	9 9	9 7	9 4	9 8	9 8
グリホサート - I P A 4 1 % S L	2 , 0 5 0	1 0 0	9 8	9 0	9 9	9 9

20

30

【 0 0 9 6】

40

50

【表 1 4】

表 1 4 ティアフェナシル丹剤微濁液の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレートの適用時、フィールド条件での生物活性 (包装試験)

試料	有効成分量 (g ai / ha)	最高効果を示す時の防除価 (%)					
		メヒシバ	E r i o c h l o a g r a c i l s	スギナ	カモジ グサ	チガヤ	D a l l i g r a s s
		5 1 c m	3 0 c m	4 0 c m	3 2 c m	5 0 c m	3 0 c m
T i a f e n a c i l 5 % M E	1 5 0	9 5	9 6	9 5	9 4	9 2	9 6
パラコートジク ロリド 2 3 . 1 % S L	1 , 1 5 5	9 4	9 4	9 4	9 5	9 6	9 5
グルホシネート - A m 1 8 % S L	9 0 0	9 7	9 9	9 5	9 6	9 6	9 9
グリホサート - I P A 4 1 % S L	2 , 0 5 0	1 0 0	-	-	1 0 0	8 9	-

【 0 0 9 7 】

表 7 ないし表 1 4 で示すように、本発明で製造されたマイクロエマルジョン剤形を含む除草剤組成物は、従来の除草剤より非常に少ない有効成分量でも、これらと比べて劣らないくらい一年生及び多年生雑草防除剤として広範囲で優れる防除価を示す。

【 0 0 9 8 】

実施例 4 . ティアフェナシル丹剤液状水和剤及び薬効増進剤を含むサンプルの防除価

薬効増進剤を含むティアフェナシル丹剤液状水和剤 (S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e , S C) に対しても、効果をティアフェナシル丹剤微濁液 (M E) と比べて確認した。

【 0 0 9 9 】

各製剤品の混合液を 1 5 0 0 L / h a の撒布物量で背負式噴霧器を使用し、有効成分量は 2 5 0 g a i / h a で雑草が大きくて非常に盛んな非農耕地状態で処理した。

【 0 1 0 0 】

試験包装にはメヒシバ、ヒエグサ、月見草が試すに十分な程度で発生した。薬効は、処理後 5 日、1 9 日、3 5 日目に % 防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価 1 0 0 % 、無処理は防除価 0 % で調査した。

【 0 1 0 1 】

10

20

30

40

50

【表 1 5】

表 1 5 ティアフェナシル丹剤液状水和剤の薬効増進剤プロポキシレート系C₉₋₁₁アルコールエトキシレート適用時の生物活性 (包装試験)

試料	有効成分 量 (g a i / h a)	防除価 (%)								
		メヒシバ (40 cm)			ヒエグサ (45 cm)			月見草 (40 cm)		
		5DA T	19D AT	35D AT	5DA T	19D AT	35D AT	5DA T	19D AT	35D AT
Tiafen acil 5 %SC	250	59	85	65	50	80	60	100	98	100
Tiafen acil 5 %ME	250	60	85	60	75	80	60	100	100	100

10

【0102】

DAT: Days after treatment、処理後の日数、表15で示すように、雑草種類及び調査日付別に防除価は少し差があり、2製品の効果は類似であった。

【0103】

20

実施例5、チアフェナシル丹高含量顆粒水和剤及び薬効増進剤を含むサンプルの防除価
チアフェナシル丹剤高含量顆粒水和剤 (Water dispersible granule、WG) の効果を評価するため、適用可能な薬効増進剤とTank mixしてチアフェナシル丹剤微濁液と比べた。

【0104】

各製剤品の混合液を1000L/h aの撒布物量でスプレースで雑草に処理した。有効成分量は25, 100g a i / h aで雑草の大きさによって製品間の効果を比べられる薬量で処理した。

【0105】

薬効は、処理後4日、10日目または2日目、6日目、14日目に%防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

30

【0106】

40

50

【表 16】

表16 ティアフェナシル丹剤高含量顆粒水和剤の薬効増進剤別の生物活性評価試験（温室試験）

試料	有効成分量 (g ai/ha)	処理後4、10日目の防除値 (%)			
		ヒエグサ (27~34 cm)		メヒシバ (28~33 cm)	
		4DAA	10DAA	4DAA	10DAA
Tiafenacil 5% ME	25	91	91	93	89
Tiafenacil 70%WG+ Hasten*0.5%	25	91	97	98	97
Tiafenacil 70%WG+ MSO**0.5%	25	94	98	97	99
Tiafenacil 70%WG+ COC***0.5%	25	96	97	97	96
Tiafenacil 70%WG+ Hasten*1%	25	95	100	97	98
Tiafenacil 70%WG+ MSO**1%	25	94	98	99	100
Tiafenacil 70%WG+ COC***1%	25	94	98	99	99

10

20

【0107】

*Spray adjuvant product (Victorian Chemical Co. Pty. Ltd.)

**Methylated Soybean Oil

***Crop Oil Concentrate

【0108】

【表 17】

30

表17 ティアフェナシル丹剤高含量顆粒水和剤と丹剤微濁液の間の生物活性比較評価（包装試験）

試料	有効成分量 (g ai/ha)	処理後2、6、14日目の防除値 (%)					
		ヒエグサ (45~60 cm)			メヒシバ (25~35 cm)		
		2DA A	6DA A	14D AA	2DA A	6DA A	14D AA
Tiafenacil 70%WG+ MSO**1%	100	87	95	80	87	100	80
Tiafenacil 5% ME	100	91	98	87	91	100	83

40

【0109】

*Spray adjuvant product (Victorian Chemical Co. Pty. Ltd.)

**Methylated Soybean Oil

***Crop Oil Concentrate

【0110】

50

チアフェナシル丹剤高含量顆粒水和剤は、現在市場で多く使用されるMSO (Methylated Soybean Oil) などのTank mix展着剤とともに処理時、微濁液と比べて雑草種類及び調査日付別に差はなく、効果が類似であった。試験に使われた3種の薬効増進剤 (Hasten、MSO、COC) の間にも効果の差はなかった。

【0111】

実施例6. グリホサートを含むチアフェナシル合剤及び薬効増進剤を含むサンプルの防除価
 除草活性化合物としてチアフェナシルグリホサート (Glyphosate) 合剤と、薬効増進剤を含むサンプルの防除価を測定した。この時、薬効増進剤としてグリホサートの薬効増進剤であるアルキルポリグルコシドに対して10重量%を使用し、チアフェナシルの薬効増進剤としてポリオキシエチレンラウリルエーテル (Polyoxyethylene lauryl ether)、ポリオキシエチレントリデシルエーテル (Polyoxyethylene tridecyl ether)、エトキシレート系C12-14アルコール、1-Dodecanaminium、N (carboxymethyl)-N,N-dimethyl-inner salt、1-Tetradecanaminium、N (carboxymethyl)-N,N-dimethyl-inner salt、グリセリン及び水を含む混合物またはポリオキシエチレンソルビタンモノラウリン (Polyoxyethylene sorbitan monolaurate) を使用した。

10

【0112】

一方、最も効果が優れる1-Dodecanaminium、N (carboxymethyl)-N,N-dimethyl-inner salt、1-Tetradecanaminium、N (carboxymethyl)-N,N-dimethyl-inner salt、Glycerine及びWaterを含む混合物に対しては、7重量%、5重量%、3重量%及び2.6重量%でそれぞれ仕入れ、仕入量による防除価を測定した。

20

【0113】

該当サンプルの撒布物量は、1000L/haにして対象雑草のヒエグサ及びメヒシバが分けつが2個である時処理した。原剤の生物活性評価時、一般的に利用する方法と同様、薬効は処理後33日目に%防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

30

【0114】

測定された%防除価は、下記表18のように示す。

【0115】

40

50

【表 18】

表 18 ティアフェナシルグリホサート合剤の薬効増進剤仕入量別防除価 (温室試験)

サン プル	除草活性化化合物	薬効増進剤 (重量%)	有効成 分量	処理後 33 日目の結 果	
				ヒエグサ (2 TL 、 54 c m)	メヒシバ (2 TL、 50 cm)
1	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + Polyoxyethylene lauryl ether (5%)	600 +12 .5	5	83
2	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + Polyoxyethylene lauryl ether (5%)	120 0+2 5	90	94
3	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + Polyoxyethylene tridecyl ether (5%)	600 +12 .5	5	85
4	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + Polyoxyethylene tridecyl ether (5%)	120 0+2 5	82	95
5	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系 C12-14 アルコール (5%)	600 +12 .5	5	85
6	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系 C12-14 アルコール (5%)	120 0+2 5	91	97
7	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1-Dodecanaminium、N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt、1-Tetradecanaminium、N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt、Glycerine 混合物 (7%)	600 +12 .5	19	90
8	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1-Dodecanaminium、N- (carboxymethyl)	120 0+2 5	97	99

10

20

30

40

50

) - N, N - dimethyl -, inner salt, 1 - Tetradecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, Glycerine混合物 (7%)			
9	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1 - Dodecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, 1 - Tetradecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, Glycerine混合物 (5%)	600 +12 .5	17	87
10	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1 - Dodecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, 1 - Tetradecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, Glycerine混合物 (5%)	120 0+2 5	96	98
11	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1 - Dodecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, 1 - Tetradecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, Glycerine混合物 (3%)	600 +12 .5	17	83
12	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + 1 - Dodecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, 1 - Tetradecanaminium, N - (carboxymethyl) - N, N - dimethyl -, inner salt, Glycerine混合物 (3%)	120 0+2 5	96	95

10

20

30

40

50

13	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) +1-Dodecanaminium, N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt, 1-Tetradecanaminium, N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt, Glycerine混合物 (2.6%)	600 +12 .5	5	77
14	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) +1-Dodecanaminium, N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt, 1-Tetradecanaminium, N- (carboxymethyl) -N, N-dimethyl-, inner salt, Glycerine混合物 (2.6%)	120 0+2 5	76	89
15	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) +Polyoxyethylene sorbitan monolaurate (5%)	600 +12 .5	5	60
16	Glyphosate+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) +Polyoxyethylene sorbitan monolaurate (5%)	120 0+2 5	63	74

【0116】

表18で示すように、Polyoxyethylene lauryl ether、Polyoxyethylene tridecyl etherを追加した場合（1番ないし4番サンプル）、防除価効果が悪くなかったが、除草活性化合物の液状水和剤（SC）剤形にビルトイン（built in）使用時、よく混ざらないで物理的安定性が落ちた。一方、チアフェナシル及びグリホサート合剤に対して薬効増進剤であるエトキシレート系C12-14アルコールまたは1-Dodecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、1-Tetradecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、グリセリン及び水を含む混合物を追加した場合（5番ないし14番サンプル）は、薬効増進剤でポリエチレンソルビタンモノラウリンを追加した場合（15番サンプル）より防除価効果が著しく増加することが分かる。また、1-Dodecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、1-Tetradecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、グリセリン及び水を含む混合物の有効成分量が増加するほど効果も増加した。一方、1-Dodecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner salt、1-Tetradecanaminium、N- (carboxymethyl) N, N dimethyl、inner sa

1 t、グリセリン及び水を含む混合物を3重量%仕入れた場合、2.6重量%仕入れた場合に比べて重量%の差が大きくないにもかかわらず、防除価が多く増加することが分かる。薬効増進剤の量をもっと増やす場合、効果の増進が期待されるが、薬効増進剤の仕入量を増加させるほど刺激性が大きくなり、材料費が上昇する恐れがあるので、チアフェナシル及びグルホシネート アンモニウム合剤に対する薬効増進剤の製品内への適正仕入率は、防除価効果に優れる3重量%ないし7重量%である。

【0117】

実施例7. グルホシネートを含むチアフェナシル合剤及び薬効増進剤を含むサンプルの防除価

除草活性化合物としてチアフェナシルグルホシネート アンモニウム (Glufosinate ammonium) 合剤と薬効増進剤を含むサンプルの防除価を測定した。この時、薬効増進剤としてグルホシネート アンモニウムの薬効増進剤であるアルキルポリグルコシドに対して10重量%と、チアフェナシルの薬効増進剤であるエトキシレート系C12-14アルコールまたはプロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレートに対して7重量%、5重量%、3重量%及び2.6重量%をそれぞれ仕入れ、ポリエチレンソルビタンモノラウリンに対して5重量%仕入れて対照群サンプル(17及び18番サンプル)で実験した。

【0118】

該当サンプルの撒布物量は1000L/haにして、対象雑草メヒシバが4葉期の時処理した。原剤の生物活性評価時に一般に利用する方法と同様、薬効は処理後3日目、10日目及び20日目に%防除価で達観評価した。達観評価方法は、雑草が完全に枯死すれば防除価100%、無処理は防除価0%で調査した。

【0119】

測定された%防除価は、下記表19のように示す。

【0120】

10

20

30

40

50

【表 19】

表19 ティアフェナシルグルホシネート-アンモニウム合剤の薬効増進剤仕入量別の防除価測定結果(温室試験)

サンプル	除草活性化化合物	薬効増進剤(重量%)	有効成分量	処理後3、10、20日目の結果		
			(g a i / h a)	メヒシバ		
				3D AA	10D AA	20D AA
1	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系C12-14アルコール(7%)	240+12	90	92	92
2			480+24	98	99	99
3	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系C12-14アルコール(5%)	240+12	85	92	91
4			480+24	96	99	99
5	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系C12-14アルコール(3%)	240+12	80	82	85
6			480+24	90	94	95
7	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + エトキシレート系C12-14アルコール(2.6%)	240+12	70	73	76
8			480+24	79	81	83
9	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + プロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレート(7%)	240+12	87	90	92
10			480+24	95	98	99
11	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + プロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレート(5%)	240+12	85	88	90
12			480+24	92	98	97
13	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + プロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレート(3%)	240+12	82	84	88
14			480+24	88	90	92
15	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + プロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレート(2.6%)	240+12	71	75	73
16			480+24	73	76	78
17	Glufosinate-ammonium+Tiafenacil	Alkylpolyglucoside (10%) + Polyoxyethylene sorbitan monolaurate (5%)	240+12	40	44	51
18			480+24	52	56	59

【0121】

表19で示すように、チアフェナシル及びグルホシネート-アンモニウム合剤に対して薬効増進剤であるエトキシレート系C12-14アルコールまたはプロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレートを追加した場合(1番ないし16番サンプル)、ポリエチレンソルビタンモノラウリンを追加した場合(17及び18番サンプル)より防除価効果が著しく増加することが分かる。また、エトキシレート系C12-14アルコールまたはプロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレートのいずれも有効成分量が増加するほど効果も増加した。一方、エトキシレート系C12-14アルコール及びプロポキシレート系C9-11アルコールエトキシレートのいずれも3重量%仕入れた場合、2.

6 重量%仕入れた場合に比べて重量%の差が大きくないにもかかわらず、防除価が多く増加することが分かる。薬効増進剤の量をもっと増やす場合、効果増進が期待されるが、薬効増進剤の仕入量を増加させるほど刺激性が大きくなり、材料費が上昇する恐れがあるので、チアフェナシル及びグルホシネート アンモニウム合剤に対する薬効増進剤の製品内への適正仕入率は防除価効果に優れる3重量%ないし7重量%である。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

- ン - グ・エキスポ - 口・ 5 0 1 ・ 1 0 9 - 5 0 3
- (72)発明者 ジュン・ヒュク・チェ
大韓民国・テジョン・ 3 4 0 4 9 ・ ユソン - グ・エキスポ - 口・ 4 4 8 ・ 4 0 5 - 6 0 7
- (72)発明者 テ・ヒュン・オ
大韓民国・テジョン・ 3 5 2 0 5 ・ ソ - グ・チョンサ - 口・ 2 8 1 ・ 2 1 3 - 7 0 1
- (72)発明者 スン・ファン・キム
大韓民国・テジョン・ 3 5 3 6 7 ・ ソ - グ・ドアンドン - 口・ 7 7 ・ 1 8 1 2 - 1 0 0 3
- (72)発明者 ヨン・オ・ジャン
大韓民国・テジョン・ 3 5 3 6 7 ・ ソ - グ・ドアンドン - 口・ 7 7 ・ 1 8 0 8 - 3 0 4
- (72)発明者 テ・ジュン・キム
大韓民国・テジョン・ 3 4 0 4 9 ・ ユソン - グ・エキスポ - 口・ 4 4 8 ・ 3 0 5 - 3 0 2
- 審査官 高橋 直子
- (56)参考文献 特表 2 0 1 5 - 5 1 4 7 2 3 (J P , A)
米国特許出願公開第 2 0 0 7 / 0 1 5 5 6 2 8 (U S , A 1)
特表 2 0 1 8 - 5 0 2 1 2 9 (J P , A)
- (58)調査した分野 (Int.Cl. , D B 名)
- A 0 1 N 2 5 / 0 0
A 0 1 N 4 3 / 5 4
A 0 1 P 1 3 / 0 0
A 0 1 N 5 7 / 2 0
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)