(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2014-505100
(P2014-505100A)
(43)公表日　平成26年2月27日(2014.2.27)

(51)Int.Cl.		F I			テーマコード（参考）
A01N 25/04	***(2006.01)***	A01N	25/04	102	4H011
A01N 43/90	***(2006.01)***	A01N	43/90	105	
A01N 43/653	***(2006.01)***	A01N	43/653	B	
A01N 51/00	***(2006.01)***	A01N	51/00		
A01N 47/40	***(2006.01)***	A01N	47/40	Z	

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 22 頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2013-553408 (P2013-553408)
(86)(22)出願日　平成23年2月11日 (2011.2.11)
(85)翻訳文提出日　平成25年10月8日 (2013.10.8)
(86)国際出願番号　PCT/US2011/024457
(87)国際公開番号　WO2012/108873
(87)国際公開日　平成24年8月16日 (2012.8.16)

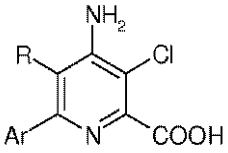
(71)出願人　501035309
ダウ　アグロサイエンシィズ　エルエルシー
アメリカ合衆国　インディアナ州　４６２６８，　インディアナポリス，　ジオンスヴィレ　ロード，　９３３０
(74)代理人　100092783
弁理士　小林　浩
(74)代理人　100120134
弁理士　大森　規雄
(74)代理人　100126354
弁理士　藤田　尚
(74)代理人　100104282
弁理士　鈴木　康仁

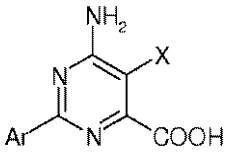
最終頁に続く

(54)【発明の名称】安定な農薬油分散体

(57)【要約】
本開示は、ジベンジリデンソルビトール又はジベンジリデンソルビトール誘導体の、農薬活性成分の油分散製剤に安定性をもたらすレオロジー添加剤としての使用に関する。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
ａ）溶媒、
ｂ）ジベンジリデンソルビトール及びジベンジリデンソルビトールのアナログのうちの少なくとも１つ、並びに
ｃ）農業用活性成分
を含む、混合物。
【請求項２】
分散剤、乳化剤、湿潤剤、消泡剤、アジュバント及び毒性緩和剤から選択される成分をさらに含む、請求項１に記載の組成物。
【請求項３】
前記組成物が１より多い増粘剤を包含する、請求項１に記載の組成物。
【請求項４】
前記増粘剤が粘土、改質粘土、シリカ、水素添加ヒマシ油、ヒマシ油誘導体、ポリアミド及びポリエステルのうちの１つである、請求項３に記載の組成物。
【請求項５】
前記農業用活性成分が１又はそれ以上の分散固体を含む、請求項１に記載の組成物。
【請求項６】
前記分散固体が、スルホンアミド、スルホニルウレア及び誘導体、アリールピリジンカルボン酸及び誘導体、アリールピリミジンカルボン酸及び誘導体、アニリド、イミダゾリノン並びにカルバゾンから構成される化学分類からの除草剤である、請求項５に記載の組成物。
【請求項７】
前記除草剤が、ピロクススラム、フロラスラム、ペノキススラム、ジフルフェニカン、チフェンスルフロン、トリベヌロン、メソスルフロン、クロピラリド、アミノピラリド、フルロキシピル、トリクロピル、ピクロラム並びに以下の構造の化合物
【化６】





及びこれらの誘導体のうちの少なくとも１つ又はその誘導体であって、式中、Ａｒが多置換フェニル基、ＲがＨ又はハロゲン及びＸがハロゲンである、請求項６に記載の組成物。
【請求項８】
前記分散固体が、安息香酸、フェノキシアルカン酸、ニトリル、ピリジンカルボン酸及びピリジルオキシカルボン酸のアルカリ金属塩又はアミン塩から構成される化学分類からの除草剤である、請求項５に記載の組成物。
【請求項９】
前記除草剤が、ジカンバ、２，４－Ｄ、ＭＣＰＡ、２，４－ＤＢ、アミノピラリド、ピクロラム、クロピラリド、ブロモキシニル、アイオキシニル、フルロキシピル及びトリクロピルのうちの少なくとも１つである、請求項８に記載の組成物。
【請求項１０】
前記農業用活性成分が、殺虫剤及び殺真菌剤のうちの少なくとも１つである、請求項１に記載の組成物。
【請求項１１】
前記農業用活性成分が、溶解された、及び部分的に溶解された農業用活性成分のうちの少なくとも１つを含む、請求項１に記載の組成物。

【請求項１２】
前記溶解された、及び部分的に溶解された前記農業活性成分の少なくとも１つが、フルロキシピルエステル、ＭＣＰＡエステル、２，４－Ｄエステル、ブロモキシニル誘導体、アイオキシニル誘導体、ジカンバエステル、２，４－ＤＢエステル、アミノピラリドエステル、ピクロラムエステル、クロピラリドエステル、トリクロピルエステル、クロジナホップエステル、シハロホップエステル、フェノキサプロップエステル、フルアジホップエステル、ハロキシホップエステル及びキザロホップエステルのうちの少なくとも１つである、請求項１１に記載の組成物。
【請求項１３】
除草剤毒性緩和剤をさらに含む、請求項１に記載の組成物。
【請求項１４】
除草剤毒性緩和剤が、クロキントセットメキシル、ベノキサコール、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミドジシクロノン、ジエトレート、フェンクロラゾールエチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェンエチル、メフェンピルジエチル、メフェナート、ナフタル酸無水物及びオキサベトリニル、及びそのアナログ及び誘導体のうちの１つである、請求項１３に記載の組成物。
【請求項１５】
昆虫、植物病又は雑草の制御に使用される請求項１に記載の組成物であって、制御が
請求項１に記載の組成物を包含する製剤を用意する工程、並びに
請求項１に記載の組成物を含有する製剤を適した農業用担体、例えば水などに希釈する工程、
請求項１に記載の組成物を包含する製剤のうちの少なくとも１つを、植物、植物に近い区域、植物茎葉、花、幹、果実、土壌、種子、発芽種子、根、液体及び固体成長培地並びに水耕法成長溶液のうちの少なくとも１つに散布する工程
を包含する、組成物。
【請求項１６】
昆虫、植物病又は雑草を制御する方法であって、
請求項１に記載の組成物を包含する製剤を用意する工程、並びに
１又はそれ以上の従来の農業用活性成分又は栄養分の製剤と混合した農業的に有効な量の製剤を、植物、植物茎葉、花、幹、果実、植物に近い区域、土壌、種子、発芽種子、根、液体及び固体成長培地並びに水耕法成長溶液のうちの少なくとも１つに散布する工程
を包含する、方法。
【請求項１７】
注入性値が５％未満であり、
ａ）溶媒、
ｂ）ジベンジリデンソルビトール及びジベンジリデンソルビトールのアナログのうちの少なくとも１つ、並びに
ｃ）農業用活性成分
を含む、油分散体。
【請求項１８】
ａ）溶媒、
ｂ）ジベンジリデンソルビトール及びジベンジリデンソルビトールのアナログのうちの１、並びに
ｃ）農業用活性成分
を含む、非水性濃厚懸濁液。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本開示は、ジベンジリデンソルビトール（ＤＢＳ）又はＤＢＳの化学的誘導体の、安定な農薬製品の油分散（ＯＤ）組成物を調製するのに有用なレオロジー改質剤としての使用

に関する。

【背景技術】

【０００２】

農薬活性成分、例えば除草剤、殺虫剤若しくは殺真菌剤又は除草剤毒性緩和剤などを、最初に製造された形で用いることは、めったにあり得ない。農薬製品は、活性成分と、製剤中で一緒に組み合わされる製剤化助剤（co-formulant）又は不活性成分との２つの部分から一般になる。これら２つの部分を組み合わせて最終製品にすることは、次の２つの主要目的を念頭に置いて行われる：（１）保存中に製品の安定性を維持すること、及び（２）製品を担体、例えば水又は油などに希釈し、処置対象の区域への噴霧散布に用いるのに簡単で有効な方法を提供すること。

【０００３】

農薬製剤は、顧客ニーズ及び活性成分の生理化学的特性、例えば、活性成分の水及び他の非水性溶媒中での溶解性に基づいて一般に設計される。製剤には２つの主要なカテゴリーである、固体製剤及び液体製剤がある。液体製剤としては、乳剤（ＥＣ）、濃厚懸濁液（ＳＣ）、可溶性液剤（ＳＬ）、フロアブル液剤（Ｆ）及び油分散体（ＯＤ）が挙げられる。ＥＣ製剤は、乳化剤が加えられた非水性溶媒中に溶解された油溶性活性成分からなる。

【０００４】

農業用ＯＤ製剤の基本的構成成分は、溶媒又は油相及び分散された固体相である。これらの基本的構成成分としては、活性成分、石油又は天然由来の溶媒、毒性緩和剤、レオロジー添加剤、乳化剤、分散剤及び製品に所望の属性を提供するのを助ける他の製剤化助剤を挙げることができる。レオロジー添加剤は、液体相の粘度を増加させることにより製剤に物理的な安定性をもたらすが、これは不溶性活性成分粒子が懸濁液から降下し、保存容器の底部で層を形成することを防ぐためである。この現象は沈降として公知であり、粒子の沈降層が分散及び再懸濁が困難な固く詰まった状態を形成した場合、製品の搬送及び使用を困難にすることがある。関係する液体製剤の物理的不安定性は、シネレシスである。ＯＤ製剤におけるシネレシスは、相分離による上部清澄部分の量として一般に測定される。

【０００５】

ＯＤ製剤中で経時的に生じる沈降の量及び重症度は、注入性試験を使用して測定することができる。この試験は、ＯＤ製剤を制御された方法で容器から注ぎ出して、容器中に残った製剤の量を測定することにより行われる。注入性値は容器中に残った物質の重量パーセントである。

【０００６】

沈降を制御するのに用いられるレオロジー添加剤は、増粘剤、固化防止剤、粘度改質剤又は構造化剤（structuring agent）としても公知なもので、一般にＯＤ製剤に粘度増加をもたらす。ＯＤ製剤の粘度を増加させるのに加えて、レオロジー添加剤は、ＯＤ製剤が形成するゲルネットワークを小さな外力をかけることで容易に破壊することを可能にする剪断減粘能力を持つ。この剪断減粘性は、ＯＤ製剤が静止時に粘度及び物理的安定性を維持するのを可能にするが、この粘度は、製品を容易に容器から注いで又は汲んで、担体、例えば水などの中で混合して必要とされる区域に散布することが可能なように外力がかけられると、急速に消失する。

【０００７】

目下、粘度を加えるのに製品中で用いられるレオロジー添加剤には、多くの形態及び化学物質がある。それらレオロジー添加剤は、ミネラル若しくはミネラルに由来するもの（例として有機粘土、ヒュームドシリカ）、膨潤性ポリマー（例としてポリアミド又は水素添加ヒマシ油）、それ自身で構造を形成する会合性増粘剤（例としてＥＯ／ＰＯブロックコポリマー）であることが可能で、又は立体分散剤（steric dispersant）（例として櫛型ポリマー、例えばポリビニルピロリジノン又はポリアクリレートなど）であることも可能である。これらのレオロジー剤又は構造化剤は、製品が静止又は保存されるときに長期

の安定性をもたらす。

【０００８】

農薬製品は一般に、散布前に水中に希釈し適切に分散させなければならない。油系の、水に非混和性の製剤を水中に分散させるのを助けるため、乳化剤系をＯＤ製剤中に包含することができる。乳化剤系は、非イオン性及びアニオン性界面活性剤の混合物を一般的に包含するが、これは様々な場所において遭遇する水の硬度及び温度の変化を適応させるためである。

【０００９】

極性相互作用のために、粘土、有機粘土、例えばベントナイト、ヘクトライト又はギブサイト粘土などの疎水性改質粘土としても公知なもの、水素添加ヒマシ油、ヒマシ油誘導体、ポリアミド、極性の酸化ワックス及び疎水化ヒュームドシリカを、非水性溶媒中でレオロジー補助剤として用いることができる。塗料中の顔料凝結制御のために、有機サルフェートを一般的に用いる。高分子量ポリマー、例えばエチルセルロース、セルロースアセトブチレート及び人工ポリマー、例えばポリアクリレート、ポリスチレン及びポリイソブチレンなどもまた、有機溶媒中で粘度を高めるのに用いることができる。最後に、石けん、例えばアルミニウムステアレート及びマグネシウムステアレートなどを粘度を高めるのに用いてもよい。

【００１０】

天然の粘土製品は一般に、広い範囲の用途に有効な増粘剤であり得る層状シリケートである。しかしながら、これらを非水性溶媒中で分散可能にするため、粘土の表面は通常四級アンモニウムを使用して処理される。これらの改質粘土は、有機粘土増粘剤として公知である。これらの強く凝集した粒子は、最初に湿らせて、次いで剪断力により分離する必要がある。高剪断混合がこのプロセスに望ましい。活性化剤、例えばアルコールなどは、粘土層の間に浸透して、散布を容易にするための緩やかな堆積物を形成するのを助ける。粘土粒子改質ＯＤ製剤の典型的なレオロジー曲線は、強い剪断減粘性及びチキソトロピックな挙動を示す。低い剪断応力では、粘土構造はいくらかの流動抵抗を示すことがある。剪断応力が増加すると共に、かけられた剪断力は進行的に粘土ネットワークを破壊し、層状粘土粒子は流れと共に動き始める。剪断が除去されると、粘土ネットワークは再形成され、粘度が再び高まる。粘土製品のタイプ及び起源に依存して、レオロジー増大効率は粘土粒子のサイズ及び形状の差によって変わることを知るのが重要である。ベーマイト粘土は、そのより大きなアスペクト比及びそれ故にその表面積によって、他のタイプの粘土よりも流体のレオロジー特性を増強するのにより有効であるように思われる。

【００１１】

水素添加ヒマシ油及びその誘導体、ポリアミド並びに極性の酸化ワックスの増粘メカニズムは水素結合に基づくが、これらの添加剤は温度効果にいくぶん感受性であることがある。水素添加ヒマシ油製品を活性化する手法は、剪断混合及び熱の両方を必要とし、その理由はこれらの製品が微粉化された粉末として搬送されるからである。有機粘土と同様に、これらの微粉化粉末は、溶媒中に完全に溶解させることなくゲル形態に分散されなければならない。第一の工程は、剪断及び熱を用いて溶媒により結晶粒子を膨潤させて、十分に分離及び分散されるようになる膨潤粒子を提供することである。活性化温度は溶媒のタイプに依存する。活性化温度を超えないように注意しなければならず、そうでなければ、ヒマシ油誘導体は完全に溶解してその増粘特性を失い、冷却すると再結晶化する。通常、これらの物質をより容易に使用するために、プレゲルを調製することが可能である。

【００１２】

３次元ネットワークを構築するのに極性相互作用を必要とする第三のタイプのレオロジー改質剤は、ヒュームドシリカに基づくものである。ヒュームドシリカは、親水性又は疎水性のいずれであっても、つながり合ったナノサイズ一次シリカ粒子から構成され、鎖形状の分離系を形成する。その非常に大きな表面積及び広範な溶媒適合性によって、ヒュームドシリカ製品は工業製品及び消費者向け製品を処方するのに広く用いられている。親水性及び疎水性のいずれのヒュームドシリカもＯＤ製剤中で増粘剤として用いることが可能

であるが、疎水性シリカは一般に、親水性シリカよりも、非水性製剤中でより制御しやすいレオロジー特性をもたらす。

【００１３】

活性成分の懸濁粒子が不可逆に沈降しやすくならないよう確保するためにＯＤ製剤中で用いられるレオロジー添加剤は、単独で又は他のレオロジー添加剤と組み合わせて用いることができる。１又はそれ以上のレオロジー添加剤を単一のＯＤ製剤中で組み合わせて、所望のレオロジー特性を得て、同時に、成分間で発生する可能性があるあらゆる有害な相互作用を最小限にすることは、非常に一般的である。ＯＤ増粘剤の適切な選定及び量は、特定の製剤の増粘効力及び適用範囲を増強することが可能である。安定なＯＤ系設計のためのレオロジー添加剤の選択において考慮すべき因子は、溶媒タイプ、乳化剤との相互作用、増粘剤活性化における頑強性、及び最終的な系の温度感受性である。

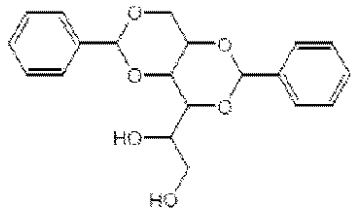
【００１４】

粒子沈降に対して農薬ＯＤ製剤を安定化させるために使用可能なレオロジー改質剤は多くある一方で、新たなレオロジー改質剤への一定のニーズがあり、これは現存の選定物が有する制限、界面活性剤との不適合性、並びに目下発見され開発されている新たな活性成分及び溶媒の化学物質の多様性のためである。加えて、単一の製剤中に包含される活性成分数の増加もまた、製剤の課題を提示し得るものである。これらの制限は、新たな様式又はより低い濃度で作用する新たなレオロジー改質剤を見出すことにより克服することができる。

【００１５】

ジベンジリデンソルビトール（ＤＢＳ、ＣＡＳ３２６４７－６７－９及び１９０４６－６４－１）は以下の構造を持っており、

【化１】

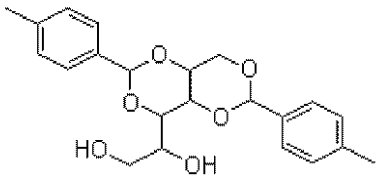


種々の有機溶媒中でゲル化の誘導又は増粘が可能な有機分子である。ＤＢＳは糖アルコールのＤ－グルシトール及びベンズアルデヒドに由来し、Ｍｉｌｌｉｋｅｎ　ＣｈｅｍｉｎａｌからＭｉｌｌｉｔｈｉｘ（登録商標）９２５として販売されている。ＤＢＳは、パーソナルケア製品、例えば制汗剤及び化粧品などにおいて、並びにまた生体材料及び電子デバイスにおいて、ゲル化剤としての使用が研究されている。ＤＢＳは、ポリオレフィン由来プラスチック用の清澄剤としての使用も見られる（Ｍｉｌｌａｄ（登録商標）３９０５）。ＤＢＳの形態学的特徴は、Ｄ．Ｊ．Ｍｅｒｃｕｒｉｏ及びＲ．Ｊ．Ｓｐｏｎｔａｋによる「Morphological Characteristics of 1,3:2,4-Dibenzylidene Sorbitol/Poly(propylene glycol) Organogels」, J. Phys. Chem. B, 105 (11) pg. 2091-2098 (2001)の中に記述されている。

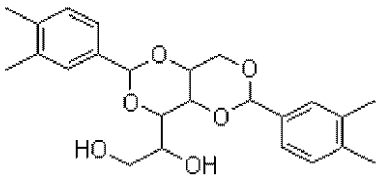
【００１６】

２つの単純なＤＢＳアナログ、メチル－ＤＢＳ（ＣＡＳ５４６８６－９７－４）及びジメチル－ＤＢＳ（ＣＡＳ１３５８６１－５６－２、Ｍｉｌｌａｄ（登録商標）３９８８）として公知であるものも、Ｍｉｌｌｉｋｅｎ　Ｃｈｅｍｉｃａｌから入手可能であり、それらそれぞれの構造を下に示す。

【化２】



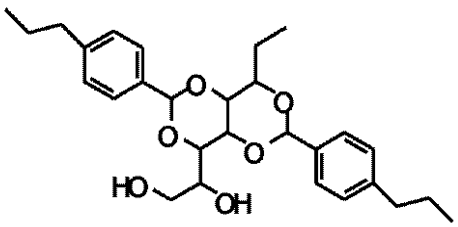
メチル-DBS



ジメチル-DBS

近年、ＮＸ８０００（ＣＡＳ８８２０７３－４３－０）として公知である新たなＤＢＳタイプの製品が、Ｍｉｌｌｉｋｅｎ　Ｃｈｅｍｉｃａｌからプラスチック用の清澄剤として販売されており、その構造を下に示す。

【化３】



NX8000

プラスチックの清澄性及び美観を亢進するためのポリオレフィン添加剤としての使用を見ている文献中に開示されているＤＢＳの化学的アナログは他に多くあって、例えば米国特許出願公開第２００７／０２４９８５０号中に開示されるようなものがあり、この文献は参照により本明細書に組み込まれる。

【先行技術文献】

【特許文献】

【００１７】

【特許文献１】米国特許出願公開第２００７／０２４９８５０号

【非特許文献】

【００１８】

【非特許文献１】「Morphological Characteristics of 1,3:2,4-Dibenzylidene Sorbitol/Poly(propylene glycol) Organogels」, J. Phys. Chem. B, 105 (11) pg. 2091-2098 (2001)

【発明の概要】

【００１９】

ＤＢＳは農薬製品のＯＤ製剤における有効なレオロジー改質剤であることが今や見出されており、改良された性能及びますます複雑になる目下開発されている製品との適合性を提供する。本開示は、望まれない植生、昆虫及び植物病を制御するのに適した農薬製品の安定なＯＤ製剤を生産するための、新たな方法及び組成物をもたらすものであり、本発明の組成物は溶媒、ジベンジリデンソルビトール又はジベンジリデンソルビトールのアナログ、及び農業用活性成分を含む。

【発明を実施するための形態】

【００２０】

本発明は、ジベンジリデンソルビトール又はジベンジリデンソルビトールのアナログの、農業用活性成分を含有するＯＤ製剤を増粘する又は粘度を加える性能が改良されたレオ

ロジー添加剤としての使用に関するが、これはかかる製剤の安定性を向上させるためのものであって、組成物は溶媒、ジベンジリデンソルビトール及びジベンジリデンソルビトールのアナログのうちの少なくとも１つ、並びに農業用活性成分を含む。

【００２１】

本開示の溶媒は、一般に、水不混和性有機溶媒であり、またトルエン、キシレン、他のアルキル化されたベンゼン等のようなベンゼン及びナフタレン誘導体に由来する芳香族炭化水素、ヘキサン、オクタン、シクロヘキサンなどのような脂肪族炭化水素、脂肪族又はイソパラフィン系の鉱油、及び芳香族及び脂肪族炭化水素の混合物のような石油蒸留物；ハロゲン化された芳香族あるいは脂肪族炭化水素；植物油、種子油、又は動物油、例えば、大豆油、菜種油、オリーブ油、ヒマシ油、ヒマワリ種子油、ココナッツ油、トウモロコシ油、綿実油、亜麻仁油、パーム油、落花生油、サフラワー油、胡麻油、桐油等、及び植物油、種子油、又は動物油に由来するＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$モノエステル類；短鎖及び長鎖のジアルキルアミド類、又は飽和又は不飽和カルボン酸；芳香族カルボン酸及びジカルボン酸のＣ$_{1}$－Ｃ$_{12}$エステル類、及び脂肪族及びシクロ脂肪族カルボン酸のＣ$_{1}$－Ｃ$_{12}$エステル類の１以上を含んでもよい。

【００２２】

さらに、上記の溶媒は、テトラヒドロフラン等のようなエーテル類、エチレングリコールモノエチルエーテル等のようなアルキレングリコールモノアルキルエーテル類又はジアルキルエーテル類、ジメチルアセトアミド又はN-メチルピロリドンのようなアミド類、メチルエチルケトン等のようなケトン類、ブチロニトリル等のようなニトリル類、ジメチルスルホキシド又はスルフォラン等のようなスルホキシド類又はスルホン類、２から１２の炭素原子を有するモノアルコール又は多価アルコール、及びプロピレン又はブチレンカーボネート等のようなアルキレンカーボネート、等の１以上の極性溶媒と混合することができるが、これらに限定されない。

【００２３】

本開示の溶媒は、全組成に対して約２００ｇ／Ｌから９９９ｇ／Ｌ、好ましくは約３００ｇ／Ｌから９５０ｇ／Ｌを構成することができる。

【００２４】

本開示のＤＢＳは、ゲル形成を通じた農薬ＯＤ形成物の粘度を高めるためのレオロジー添加剤として用いられる。これは、分散された活性成分が溶媒中で懸濁状態を保つのを助け、製剤の不安定性及び劣った製品性能に寄与し得る活性成分の沈下及び沈降を阻害する。他の構成成分を加える前に、ＤＢＳを溶媒中に分散し、適切に活性化することができる。結果として得られる、ゲル形態の活性化ＤＢＳを含有する混合物は、良好な剪断減粘特性を一般に示す。ＤＢＳは、全組成に対して約０．１ｇ／Ｌから１００ｇ／Ｌ、好ましくは約０．１ｇ／Ｌから５０ｇ／Ｌを構成することができる。

【００２５】

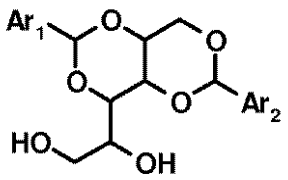
本開示のさらなる実施形態として、ＤＢＳを、沈降を阻害することにより改良された物理的安定性をもたらすために農薬ＯＤ製剤中で一般的に用いられる１又はそれ以上の現存のレオロジー添加剤と組み合わせて用いることができる。ＤＢＳと共に用いるのに適したレオロジー添加剤は、粘土、改質粘土、シリカ又はヒュームドシリカ、水素添加ヒマシ油、ヒマシ油誘導体、ポリアミド及びポリエステルのうちの１又はそれ以上を含むことができる。適したレオロジー添加剤と組み合わせて用いられるＤＢＳは、全組成に対して約０．１ｇ／Ｌから１００ｇ／Ｌ、好ましくは約０．１ｇ／Ｌから５０ｇ／Ｌを構成することができる。ＤＢＳと組み合わせて用いられる適したレオロジー添加剤は、全組成に対して約０．１ｇ／Ｌから２００ｇ／Ｌ、好ましくは約０．２ｇ／Ｌから１００ｇ／Ｌを構成することができる。

【００２６】

本開示のさらなる実施形態として、ＤＢＳのアナログを単独で、ＤＢＳと組み合わせて、又はかかる製剤の粘度を増加させることにより物理的な安定性をもたらすために農業用ＯＤ製剤中で用いられる１若しくはそれ以上の現存のレオロジー添加剤と組み合わせて、

用いることができる。これらのアナログは、以下の構造を含むことができる。

【化４】



式中、Ar_1及びAr_2は、同じ若しくは異なる一置換又は多置換のフェニル環基である。置換されたフェニル基は、C_1－C_{10}アルキル、C_1－C_{10}ハロアルキル、C_1－C_{10}アルコキシ、C_1－C_{10}ハロアルコキシ、C_1－C_{10}アルキルチオ、C_1－C_{10}ハロアルキルチオ、C_1－C_{10}ハロアルキルスルフィニル、C_1－C_{10}ハロアルキルスルフォニル、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、カルボン酸及びその誘導体、シアノ、アミノ、C_1－C_{10}アルキルアミノ、C_1－C_{10}ジアルキルアミノ、C_1－C_{10}アルキルカルボニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、C_1－C_{10}アルキルフェニルカルボニルアミノ、C_1－C_{10}アルキルスルホニルアミノ及びフェニルスルホニルアミノからなる群から選択される１以上の置換基を含んでもよいが、これらに限定されない。

【００２７】

本開示の農薬活性成分は、除草剤、殺虫剤及び殺真菌剤の群から選択することができる。活性成分は溶媒中での溶解性が非常に低い分散固体として存在してもよく、又は溶媒中で完全に可溶若しくは部分的に可溶であってもよい。好ましい分散性活性成分は一般に、溶媒相中での溶解性が低く（＜１０ｇ／Ｌ）、より高溶融性（＞５０℃）の固体である。好ましい可溶又は部分的に可溶な活性成分は一般に、溶媒相中での溶解性が中程度から高く（＞１０ｇ／Ｌ）、より低溶融性（＜１５０℃）の固体である。

【００２８】

本発明の分散固体除草剤活性成分としては、スルホンアミド、スルホニルウレア、アリールピリジンカルボン酸及びアナログ、アリールピリミジンカルボン酸及びアナログ、アニリド、イミダゾリノン並びにカルバゾンが挙げられるが、これらに限定されるものではない。また、安息香酸、フェノキシアルカン酸、ピリジンカルボン酸及びピリジルオキシカルボン酸のアルカリ金属塩又はアミン塩である除草剤もまた、本発明の分散された活性成分を構成することができる。

【００２９】

溶媒相中の分散に特に適している除草剤は、トリアスルフロン、トリベヌロン、メタスルフロン、チフェンスルフロン、フルピルスルフロン、ヨードスルフロン、リムスルフロン、ニコスルフロン、シノスルフロン、ベンスルフロン、トリフロキシスルフロン、フォラムスルフロン、メソスルフロン、スルフォスルフロン、トリトスルフロン及びその誘導体、さらにフルメツラム、メトスラム、クロランスラム、フロラスラム、ジクロスラム、ペノキススラム、ピロキシスラム及びその誘導体、ジフルフェニカン、さらにイマゼタベンズ、イマゼタピル、イマザキン、イマザモックス及びその誘導体、及びフルカルバゾン、プロポキシカルバゾン、アミカルバゾン及びその誘導体、また以下のジェネリック構造の化合物、又はその誘導体、

【化５】



米国特許第７３１４８４９号及び米国特許第７３００９０７号に示されるように、式中、アルゴンは多置換のフェニル基であり、ＲはＨ又はハロゲンであり、Ｘはハロゲンである。

【００３０】

溶媒相中の分散に特に適している追加の除草剤は、ジカンバ、２，４－Ｄ、ＭＣＰＡ、２，４－ＤＢ、アミノピラリド、ピクロラム、クロピラリド、フルロキシピル及びトリクロピルのアルカリ金属又はアミン塩、及びブロモキシニルとアイオキシニルのアルカリ金属塩である。アミン類は、第一級、第二級又は第三級のアルキルアミン類、アルカノールアミン類、アルキルアルカノールアミン類、又はアルコキシアルカノールアミン類で構成され、この場合、アルキル基及びアルカノール基は、飽和状態であり、C_1－C_4アルキル基を個々に含んでいる。アルカリ金属はナトリウムとカリウムで構成される。

【００３１】

使用時点でさらに希釈することができる本開示のＯＤ製剤の場合、溶媒分散性の除草剤は、全組成に対して約１ｇ／Ｌから７００ｇ／Ｌ、好ましくは約５ｇ／Ｌから５００ｇ／Ｌを構成することができる。この濃縮製剤を農業での慣行に応じて使用時点で１から２０００倍に希釈することができるのは、一般的に公知である。

【００３２】

本開示のさらなる実施形態は、溶媒に可溶な又は部分的に溶媒に可溶な活性成分及び毒性緩和剤の添加を含む。これらの活性成分及び毒性緩和剤としては、除草剤、殺虫剤、殺真菌剤及び除草剤毒性緩和剤のうちの１又はそれ以上が挙げられ、限定されるものではないが、カルボン酸エステル、リン酸エステル又は硫酸エステルの駆除剤がある。

【００３３】

本発明の適した可溶性の、部分的に可溶性の除草剤有効成分は、ジカンバエステル類のような安息香酸系除草剤、２，４－Ｄ、ＭＣＰＡあるいは２，４－ＤＢエステル類のようなフェノキシアルカン酸系除草剤、クロジナホップ、シハロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ及びキザロホップエステル類のようなアリールオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、アミノピラリド、ピクロラム及びクロピラリドエステル類のようなピリジンカルボン酸系除草剤、フルロキシピル及びトリクロピルエステル類のようなピリジルオキシカルボン酸、及びブロモキシニルとアイオキシニル及びそのエステル類のようなニトリル系除草剤を含むが、これらに限定されない。

【００３４】

本開示の適した可溶性の又は部分的に可溶性の除草剤毒性緩和剤は、クロキントセットメキシル、ベノキサコール、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミドジシクロノン、ジエトレート、フェンクロラゾールエチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェンエチル、メフェンピルジエチル、メフェナート、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル及び誘導体及びそのアナログを含んでもよいが、これらに限定されない。

【００３５】

本発明の溶媒に可溶な又は部分的に溶媒に可溶な除草剤活性成分又は除草剤毒性緩和剤は、全組成に対して約１ｇ／Ｌから７００ｇ／Ｌ、好ましくは約５ｇ／Ｌから５００ｇ／Ｌを構成することができる。

【００３６】

本開示の付加的な農業用活性成分としては、殺虫剤及び殺真菌剤を挙げることができる。これらの活性成分は、分散固体又は可溶若しくは部分的に可溶な活性成分として存在することができる。

【００３７】

本開示の適した殺虫剤活性成分としては、抗生物質殺虫剤、大環状ラクトン殺虫剤（例えばアベルメクチン殺虫剤、ミルベマイシン殺虫剤及びスピノシン殺虫剤）、ヒ素殺虫剤、植物性殺虫剤、カルバメート殺虫剤（例えばベンゾフラニルメチルカルバメート殺虫剤、ジメチルカルバメート殺虫剤、オキシムカルバメート殺虫剤及びフェニルメチルカルバメート殺虫剤）、ジアミド殺虫剤、乾燥剤殺虫剤、ジニトロフェノール殺虫剤、フッ素殺虫剤、ホルムアミジン殺虫剤、燻蒸剤殺虫剤、無機殺虫剤、昆虫成長調節剤（例えばキチン合成阻害剤、幼若ホルモン類似体、幼若ホルモン、脱皮ホルモンアゴニスト、脱皮ホルモン、脱皮阻害剤、プレコセン及び他の未分類の昆虫成長調節剤）、ネライストキシンアナログ殺虫剤、ニコチノイド殺虫剤（例えばニトログアニジン殺虫剤、ニトロメチレン殺虫剤及びピリジルメチルアミン殺虫剤）、有機塩素殺虫剤、有機リン殺虫剤、オキサジアジン殺虫剤、オキサジアゾロン殺虫剤、フタルイミド殺虫剤、ピラゾール殺虫剤、ピレスロイド殺虫剤、ピリミジンアミン殺虫剤、ピロール殺虫剤、テトラミン酸殺虫剤、テトロン酸殺虫剤、チアゾール殺虫剤、チアゾリジン殺虫剤、チオ尿素殺虫剤、尿素殺虫剤、同様に他の未分類の殺虫剤が挙げられるが、これらに限定されるものではない。

【００３８】

本文書に開示された発明と組み合わせて有益に使用することができる特定の殺虫剤のうちのいくつかは、以下の１，２－ジクロロプロパン、１，３－ジクロロプロペン、アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アセチオン、アセトプロール、アクリナトリン、アクリロニトリル、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アルドリン、アレトリン、アロサミジン、アリキシカルブ、アルファシペルメトリン、アルファエンドスルファン、アミジチオン、アミノカルブ、アミトン、アミトラズ、アナバシン、アチダチオン、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、アゾトアート、バリウムヘキサフルオロケイ酸塩、バルトリン、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベータシフルトリン、ベータシペルメトリン、ビフェントリン、ビオアレトリン、ビオエタノメトリン、バイオペルメトリン、ビオレスメトリン、ビストリフルロン、ホウ砂、ホウ酸、ホウ酸、ブロムフェンビンホス、ブロモシクレン、臭素ＤＤＴ、ブロモホス、ブロモホス－エチル、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブタカルブ、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブトネート、ブトキシカルボキシム、カズサホス、砒酸カルシウム、カルシウム多硫化物、カンフェクロール、カーバノレート、カルバリル、カルボフラン、二硫化炭素、四塩化炭素、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルビシクレン、クロルデン、クロルデコン、クロルジメホルム、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンビンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロロホルム、クロロピクリン、クロルホキシム、クロルプラゾホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロルチオホス、クロマフェノジド、シネリンＩ、シネリンＩＩ、シスメトリン、クロエトカルブ、クロサンテル、クロチアニジン、アセト亜ヒ酸銅、ヒ酸銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、クマホス、クミトアート、クロタミトン、クロトキシホス、クルホメート、氷晶石、シアノフェンホス、シアノホス、シアントアート、シアントラニリプロール、シクレトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シペルメトリン、シフェノトリン、シロマジン、シチオエート、ＤＤＴ、デカルボフラン、デルタメトリン、デメフィオン、デメフィオン－Ｏ、デメフィオン－Ｓ、デメトン、デメトンメチル、デメトン－Ｏ、デメトン－Ｏ－メチル、デメトン－Ｓ、デメトン－Ｓ－メチル、デメトン－Ｓ－メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、珪藻土、ダイアジノン、ジカプトン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジクレシル、ジクロトホス、ジシクラニル、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジロール、ジメフルトリン、ジメフォックス、ジメタン、ジメトエート、ジメトリン、ジメチルビンホス、ジメチラン、ジネックス、ジノプロップ、ジノサム、ジノテフラン、ジオフ

ェノラン、ジオキサベンゾホス、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジスルホトン、ジチクロホス、ｄ－リモネン、ＤＮＯＣ、ドラメクチン、エクジステロン、エマメクチン、ＥＭＰＣ、エンペントリン、エンドスルファン、エンドチオン、エンドリン、ＥＰＮ、エポフェノナン、エプリノメクチン、エスフェンバレレート、エタホス、エチオフェンカルブ、エチオン、エチプロール、エトアート－メチル、エトプロホス、ギ酸エチル、エチル－ＤＤＤ、二臭化エチレン、二塩化エチレン、エチレンオキシド、エトフェンプロックス、エトリムホス、ＥＸＤ、ファンファー、フェナミホス、フェナザフロル、フェンクロルホス、フェネタカルブ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンピリトリン、フェンプロパトリン、フェンスルフォチオン、フェンチオン、フェンチオンエチル、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジアミド、フルコフロン、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルバリネート、ホノホス、ホルメタナート、フォルモチオン、ホルムパラナート、ホスメチラン、ホスピレート、ホスチエタン、フラチオカルブ、フレトリン、ガンマシハロトリン、ガンマ－ＨＣＨ、ハルフェンプロックス、ハロフェノジド、ＨＣＨ、ＨＥＯＤ、ヘプタクロル、ヘプテノホス、ヘテロホス、ヘキサフルムロン、ＨＨＤＮ、ヒドラメチルノン、シアン化水素、ヒドロプレン、ヒキンカルブ、イミダクロプリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードメタン、ＩＰＳＰ、イサゾホス、イソベンザン、イソカルボホス、イソドリン、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソプロチオラン、イソチオアート、イソキサチオン、イベルメクチン、ジャスモリンＩ、ジャスモリンＩＩ、ヨードフェンホス、幼若ホルモンＩ、幼若ホルモンＩＩ、幼若ホルモンＩＩＩ、ケレバン、キノプレン、ラムダシハロトリン、ヒ酸鉛、レピメクチン、レプトホス、リンデン、リリンホス、ルフェヌロン、リチダチオン、マラチオン、マロノベン、マジドックス、メカルバム、メカルホン、メナゾン、メフォスフォラン、塩化第一水銀、メスルフェンホス、メタフルミゾン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メトクロトホス、メソミル、メトプレン、メトキシクロール、メトキシフェノジド、臭化メチル、メチルクロロホルム、塩化メチレン、メトフルトリン、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、メキサカルバート、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミパフォックス、マイレックス、モノクロトホス、モルホチオン、モキシデクチン、ナフタロホス、ナレド、ナフタレン、ニコチン、ニフルリジド、ニテンピラム、ニチアジン、ニトリラカルブ、ノバルロン、ノビフルムロン、オメトエート、オキサミル、オキシデメトンメチル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、パラジクロロベンゼン、パラチオン、パラチオンメチル、ペンフルオン、ペンタクロロフェノール、ペルメトリン、フェンカプトン、フェノトリン、フェントエート、ホラート、ホサロン、ホスホラン、ホスメット、ホスニクロル、ホスファミドン、ホスフィン、ホキシム、ホキシムメチル、ピリメタホス、ピリミカーブ、ピリミホスエチル、ピリミホスメチル、亜ヒ酸カリウム、チオシアン酸カリウム、ｐｐ’－ＤＤＴ、プラレトリン、プレコセンＩ、プレコセンＩＩ、プレコセンＩＩＩ、プリミドホス、プロフェノホス、プロフルトリン、プロマシル、プロメカルブ、プロパホス、プロペタンホス、プロポキスル、プロチダチオン、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブト、ピラクロホス、ピラフルプロール、ピラゾホス、ピレスメトリン、ピレトリンＩ、ピレトリンＩＩ、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリフルキナゾン、ピリミジフェン、ピリミテート、ピリプロール、ピリプロキシフェン、カシア、キナルホス、キナルホスメチル、キノチオン、ラフォキサニド、レスメトリン、ロテノン、リアニア、サバジラ、シュラーダン、セラメクチン、シラフルオフェン、シリカゲル、亜ヒ酸ナトリウム、フッ化ナトリウム、ナトリウムヘキサフルオロケイ酸塩、チオシアン酸ナトリウム、ソファミド、スピネトラム、スピノサド、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルコフロン、スルフォキサフロル、スルフルラミド、スルホテップ、フッ化スルフリル、スルプロホス、タウーフルバリネート、タジムカルブ、ＴＤＥ、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、ＴＥＰＰ、テラレスリン、テルブホス、テトラクロロエタン、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフル

スリン、シータシペルメトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チクロホス、チオカルボキシム、チオシクラム、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオスルタップ、チューリンゲンシン（ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｎ）、トルフェンピラド、トラロメトリン、トランスフルトリン、トランスペルメトリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、トリクロルホン、トリクロルメタホス－３、トリクロロナート、トリフェノホス、トリフルムロン、トリメタカリブ、トリプレン、バミドチオン、バニリプロール、ＸＭＣ、キシリルカルブ、ズイーター－シペルメトリン、及びα－エクジソンを含むが、これらに限定されない。

【００３９】

加えて、上の殺虫剤のあらゆる組み合わせを用いることが可能である。

【００４０】

本開示の適した殺真菌剤活性成分はまた、他の殺真菌剤と組み合わせて、殺真菌性混合物及びその相乗的混合物を形成することもできる。本開示の殺真菌性化合物は、より広範で種々の望ましくない疾病を制御するため、しばしば１又はそれ以上の他の殺真菌剤と一緒に散布される。他の殺真菌剤と一緒に用いられる場合、本特許請求の範囲に記載された化合物は、他の殺真菌剤と共に処方し、他の殺真菌剤とタンク混合し、又は他の殺真菌剤と共に連続的に散布することができる。他のこのような殺真菌剤は、２－チオシアナトメチルチオ）－ベンゾチアゾール、２－フェニルフェノール、８－ヒドロキシキノリン硫酸塩、アメトクトラジン、アミスルブロム、アンチマイシン、アンペロミセスキスカリス、アザコナゾール、アゾキシストロビン、枯草菌（Bacillus subtilis）、ベナラキシル、ベノミル、ベンチアバリカルブイソプロピル、ベンジルアミノベンゼン－スルフォナート（ＢＡＢＳ）塩、重炭酸塩、ビフェニル、ビスメルチアゾール、ビテルタノール、ビキサフェン、ブラスチシジン－Ｓ、ホウ砂、ボルドー液、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブピリメート、カルシウム多硫化物、カプタホール、キャプタン、カルベンダジム、カルボキシン、カルプロパミド、カルボン、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、コニオチリウムミニタンス（Coniothyrium minitans）、水酸化銅、銅オクタノアート、オキシ塩化銅、硫酸銅、硫酸銅（三塩基性）、酸化銅（Ｉ）、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、二アンモニウムエチレンビス－（ジチオカルバマート）、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾクアットイオン、ジフルメトリム、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール－Ｍ、ジノブトン、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジチアノン、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、ドジン、ドジン遊離塩基、エジフェンホス、エネストロビン、エポキシコナゾール、エタボキサム、エトキシキン、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチン、酢酸トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ、ファーバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオルイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホル、フォルペット、ホルムアルデヒド、ホセチル、ホセチルアルミニウム、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、グアザチン、グアザチンアセタート、ＧＹ－８１、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イマザリル硫酸塩、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジントリアセテート、イミノクタジントリス（アルベシル酸塩）、イプコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、クレキシムメチル、マンカッパー、マンコゼブ、マンジプロパミド、マンネブ、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、酸化第二水銀、塩化第一水銀、メタラキシル、メフェノキサム、メタラキシル－Ｍ、メタム、メタムアンモニウム、メタムカリウム、メタムナトリウム、メトコナゾール、メタスルホカルブ、ヨウ化メチル、メチルイソチオシア

ナート、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、ミルジオマイシン、ミクロブタニル、ナバム、ニトロタールイソプロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフラセ、オレイン酸（脂肪酸）、オリサストロビン、オキサジキシル、オキシン銅、オキスポコナゾールフマル酸塩、オキシカルボキシン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ラウリン酸ペンタクロロフェニル、ペンチオピラド、フェニル水銀アセタート、ホスホン酸、フタリド、ピコキシストロビン、ポリオキシンＢ、ポリオキシン類、ポリオキソリム、重炭酸カリウム、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロピコナゾール、プロビネブ、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブチカルブ、ピリフェノックス、ピリメサニル、ピロキロン、キノクラミン、キノキシフェン、キントゼン、レイノウトリア・サカリネンシス（Reynoutria sachalinensis）抽出物、セダキサン、シルチオファム、シメコナゾール、ナトリウム２－フェニルフェノキシド、重炭酸ナトリウム、ナトリウムペンタクロロフェノキシド、スピロキサミン、硫黄、ＳＹＰ－Ｚ０７１、ＳＹＰ－Ｚ０４８、タール油、テブコナゾール、テブフロキン、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネートメチル、チウラム、チアジニル、トルクロホス－メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダマイシン、バリフェナラート、バリフェナール、ビンクロゾリン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド、カンジダ・オレオフィラ（Candida oleophila）、フザリウム・オキシスポラム（Fusarium oxysporum）、グリオクラジウム属種（Gliocladium spp.）、フレビオプシス・ギガンテア（Phlebiopsis gigantea）、ストレプトマイセス・グリセオビリジス（Streptomyces griseoviridis）、トリコデルマ属種（Trichoderma spp.）、（ＲＳ）－Ｎ－（３，５－ジクロロフェニル）－２－（メトキシメチル）－スクシンイミド、１，２－ジクロロプロパン、１，３－ジクロロ－１，１，３，３－テトラフルオロアセトン水和物、１－クロロ－２，４－ジニトロナフタレン、１－クロロ－２－ニトロプロパン、２－（２－ヘプタデシル－２－イミダゾリン－１－イル）エタノール、２，３－ジヒドロ－５－フェニル－１，４－ジチイン１，１，４，４－四酸化物、２－メトキシエチル水銀アセタート、２－メトキシエチル水銀クロリド、２－メトキシエチル水銀ケイ酸塩、３－（４－クロロフェニル）－５－メチルロダニン、４－（２－ニトロプロパノール－１－エニル）フェニルチオシアン酸塩、アンプロピルホス、アニラジン、アジチラム、バリウム多硫化物、Ｂａｙｅｒ３２３９４、ベノダニル、ベンキノックス、ベンタルロン、ベンザマクリル；ベンザマクリルイソブチル、ベンズアモルフ、ビナプアクリル、ビス（メチル水銀）硫酸塩、ビス（トリブチルスズ）オキシド、ブチオベート、カドミウムカルシウム銅亜鉛クロム硫酸塩、カルバモルフ、ＣＥＣＡ、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロルフェナゾール、クロルキノックス、クリンバゾール、銅ビス（３－サリチル酸フェニル）、クロム酸銅亜鉛、クフラネブ、硫酸ヒドラジニウム第二銅、クプロバム、シクラフルアミド、シペンダゾール、シプロフラン、デカフェンチン、ジクロン、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、ジメチリモール、ジノクトン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジピリチオン、ジタリムホス、ドジシン、ドラゾキソロン、ＥＢＰ、ＥＳＢＰ、エタコナゾール、エテム、エチリム、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェニトロパン、フルオトリマゾール、フルカルバニル、フルコナゾール、フルコナゾールシス、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン、グリセオフルビン、ハラクリネート、Ｈｅｒｃｕｌｅｓ　３９４４、ヘキシルチオフォス、ＩＣＩＡ０８５８、イソパムホス、イソバレジオン、メベニル、メカルビンジド、メタゾキソロン、メトフロキサム、メチル水銀ジシアンジアミド、メトスルホバックス、ミルネブ、ムコクロリン酸無水物、ミクロゾリン、Ｎ－３，５－ジクロロフェニル－スクシンイミド、Ｎ－３－ニトロフェニルイタコンイミド、ナタマイシン、Ｎ－エチルメルクリオ－４－トルエンスルホンアニリド、ニッケルビス（ジメチルジチオカルバマート）、ＯＣＨ、フェニル水銀ジメチルジチオカルバマート、フェニル水銀硝酸

塩、ホスダイフェン、プロチオカルブ；プロチオカルブ塩酸塩、ピラカルボリド、ピリジニトリル、ピロキシクロル、ピロキシフル、キナセトール；キナセトール硫酸塩、キナザミド、クインコナゾール、ラベンザゾール、サリチルアニリド、ＳＳＦ－１０９、スルトロペン、テコラム、チアジフルア、チシオフェン、チオクロルフェンフィム、チオファネート、チオキノックス、チオキシミド、トリアミホス、トリアリモール、トリアズブチル、トリクラミド、ウルバシド、ＸＲＤ－５６３、そしてザリルアミド、ＩＫ－１１４０及び任意の組み合わせを含んでもよい。

【００４１】

本開示の殺虫剤又は殺真菌剤活性成分は、全組成に対して約１ｇ／Ｌから７００ｇ／Ｌ、好ましくは約５ｇ／Ｌから５００ｇ／Ｌを構成することができる。

【００４２】

１又はそれ以上の界面活性剤を本発明の組成物中に組み入れるのが、通常望ましい。界面活性剤は、アニオン性、カチオン性又は非イオン性の性質であり得るもので、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として又は他の目的のために利用可能である。製剤分野において従来用いられ、本製剤においても用いることができる界面活性剤は、特に、「McCutcheon’s Detergents and Emulsifiers Annual」, MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1998及び「Encyclopedia of Surfactants」, Vol. I-III, Chemical publishing Co., New York, 1980-81中に記述されている。典型的な界面活性剤としては、ジエタノールアンモニウムラウリル硫酸塩のような硫酸アルキルの塩類;カルシウムドデシルベンゼンスルフォナートのようなアルキルアリールスルフォン酸塩塩類;ノニルフェノール-C_{18}エトキシレートのようなアルキルフェノール-アルキレン酸化物付加生成物;トリデシルアルコール-C_{16}エトキシレートのようなアルコールアルキレンオキシド付加物;ステアリン酸ナトリウムのような石けん;ナトリウムジブチルナフタレンスルフォナートのようなアルキルナフタレン-スルフォナート塩類;ナトリウムジ(２－エチルヘキシル)スルホサクシネートのようなスルホン酸塩類のジアルキルエステル;ソルビトールオレアートのようなソルビトールエステル;ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドのような第四級アミン;ポリエチレングリコールステアリン酸塩のような脂肪酸のポリエチレングリコールエステル類;エチレンオキシドとプロピレンオキシドのブロック共重合体;モノアルキルリン酸エステル類及びジアルキルリン酸エステル類の塩類;ダイズ油、菜種油、オリーブ油、ヒマシ油、ヒマワリ種子油、ココナッツ油、トウモロコシ油、綿実油、亜麻仁油、パーム油、落花生油、サフラワー油、胡麻油、桐油のような植物油;及び上記の植物油のエステル類が挙げられる。

【００４３】

本開示の組成物は、１又はそれ以上の付加的な不活性成分、例えば消泡剤、アジュバント、安定剤、芳香剤、金属イオン封鎖剤、中和剤、バッファー、防錆剤、染料、着臭剤及び他の一般的に用いられる成分などを任意選択で包含することができる。

【００４４】

典型的な農業用途に利用される本開示のＯＤ製剤の有効量は、例えば、植物のタイプ、植物の成長ステージ、環境条件の重症度、制御対象の雑草、昆虫又は病原真菌及び散布条件にしばしば依存する。典型的に、雑草若しくは昆虫からの保護又は病因の制御若しくは排除の必要がある植物を、約１から約４０，０００ｐｐｍ、好ましくは約１０から約２０，０００ｐｐｍの活性成分量をもたらす量の、担体、例えば水などで希釈されたＯＤ製剤と接触させる。接触は、任意の有効な様式で行うことができる。例えば、植物の任意の露出部分、例として葉又は幹に、適した量の希釈剤又は担体、例えば水などと混合した活性成分を噴霧することができる。

【００４５】

前述の本発明の組成物は、植物茎葉又は植物に近い土壌若しくは区域に散布することができる。加えて、本発明の組成物は、農業用活性成分、例えば除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺生物剤、殺シロアリ剤、殺鼠剤、軟体生物駆除剤、節足動物駆除剤、肥料、成長調節剤及びフェロモンなどと混合すること、又はこれらとの任意の組み合

わせで散布することができる。

【００４６】

本発明のＯＤ製剤を調製する典型的な手法において、剪断混合及び熱を使用して溶媒中でＤＢＳを分散させること及び活性化させることにより、ＤＢＳのプレゲルを最初に調製する。室温に冷却した後、ＤＢＳのプレゲルを次いで、活性成分及び任意の他の成分を溶媒と共に剪断混合することにより予め形成された混合物へと混合しながら添加する。

【００４７】

分散された活性成分の沈降をＤＢＳにより遅らせる本開示の安定なＯＤ製剤の例は、

ａ）全組成に対して約２００ｇ／Ｌから約９９９ｇ／ＬのＡｒｏｍａｔｉｃ２００ＮＤを含む溶媒、

ｂ）全組成に対して約０．１ｇ／Ｌから約１００ｇ／Ｌのジベンジリデンソルビトールを含むレオロジー添加剤

ｃ）全組成に対して約１ｇ／Ｌから約２００ｇ／Ｌのピロクススラムを含む活性成分、

ｄ）任意選択で、他の不活性製剤成分

を含む。

【実施例】

【００４８】

ＤＢＳを適切に活性化するため、芳香族溶媒（例としてＥｘｘｏｎＭｏｂｉｌからのナフタレン除去Ａｒｏｍａｔｉｃ２００）中の１．５％ ＤＢＳプレゲル溶液を調製したが、この調製は、１．５ｇのＤＢＳを９８．５ｇのＡｒｏｍａｔｉｃ２００中に高剪断下で分散させ、混合物を５０～５５℃へと１５分間加熱して、混合物を低剪断混合下で室温へと冷却することにより行った。結果として得られた混合物は、外観が半透明から透明で、高度にチキソトロピックなゲル特性を示すものであった。

【００４９】

表１中に示した本開示の組成物を、以下の手法を用いて調製した。１）表１中に示した量の溶媒を、機械的スターラーを備えたガラスビーカー中に入れた。２）１．５％ ＤＢＳプレゲルを一定の混合下でビーカー中に加えた。３）活性成分を次いで混合物に加えた。４）混合物を均質になるまで撹拌し、次いで１０分間超音波処理して、試験試料を提供した。全ての試料は、室温で２４時間後、目視検査による沈降に対して安定であった。

【表１】

表１．沈降に対する安定性の評価のための本開示の組成物

製剤#	有効成分(AI)	AI量、g	溶媒	溶媒の量、g	芳香族200ND中1.5% DBS、g
1	フロラスラム	0.2	芳香族200ND	10	10
2	ペノキススラム	0.4	芳香族200ND	10	10
3	ピロキシスラム	1	芳香族200ND	10	10
4	フェンブコナゾール	1	芳香族200ND	10	10
5	イミドクロプリド(imidcloprid)	2	芳香族200ND	10	10
6	スルフォキサフロル	2	エクソールD-110	10	10

下の表２中に指し示すように、試料７及び８を、示した成分を使用して以下の手法により調製した。最初にＡｒｏｍａｔｉｃ２００ＮＤを、機械的スターラーを備えたガラスビーカー中に入れた。Ｂｅｎｔｏｎｅ３８粉末を次いで高剪断下でビーカーに加え、粉末の完全な分散を確実にした。Ｔｅｎｓｉｏｆｉｘ　Ｎ９８２４ＨＦ及びプロピレンカーボネートを次いで一定の混合下で加えた。最後に１．５％ ＤＢＳプレゲルを混合物に加えて、試料７を提供した。試料８にはＤＢＳを加えなかった。試料７及び８の両方を次いで、保存安定性査定のため、１００ｍＬのガラスボトル中に詰めた。試料を室温で７ヶ月間、乱さずに保存した。シネレシスのパーセンテージを両試料において視覚的に測定したところ、製剤７は８．７％の上部清澄部分を示した一方、製剤８は５７．１％の上部清澄部分を示した。ＤＢＳを包含させることの効果は、各試料の相分離量が異なることにより明らかであった。

【表２】

表２．ＤＢＳを加えた及び加えないＯＤ製剤の、室温で７ヶ月保存した後のシネレシスに対する安定性

成分	製剤 7	製剤 8
	量、g	量、g
芳香族 200ND	48	48
ベントン 38 粘土	2	2
テンシオフィックス N9824HF	5	5
炭酸プロピレン	0.7	0.7
1.5% DBS プレゲル	0.75	0.0
%シネレシス（上部清澄部分）	8.7%	57.1%

【００５０】

下の表３中に指し示すように、試料９及び１０を、示した成分を使用して以下の手法により調製した。最初にＡｒｏｍａｔｉｃ２００ＮＤを、機械的スターラーを備えたガラスビーカー中に入れた。Ｂｅｎｔｏｎｅ３４粉末を次いで高剪断下でビーカーに加え、粉末の完全な分散を確実にした。Ｔｅｎｓｉｏｆｉｘ界面活性剤及びプロピレンカーボネートを次いで一定の混合下で加えた。活性成分ピロクススラム及び毒性緩和剤クロキントセットーメキシルを加え、高剪断混合を使用して完全に分散させた。残りの成分を次いで、最後の成分としてＤＢＳをＡｒｏｍａｔｉｃ２００ＮＤ中の１．５％ プレゲルとして加えること以外は特定の順番なく加え、製剤１０を提供した。両試料を次いで、保存安定性査定のため、ガラスボトル中に詰めた。

【表３】

表３．製剤試料９及び１０の組成

成分	製剤 9	製剤 10
	量、g	量、g
クロキントセットメキシル	9	9
ピロキシスラム	4.5	3
ベントン 38	2	
ベントン 34		3
DBS	0.15	0.2
チクシン R	0.05	
アトロクス 4912	1	1
テンシオフィックス N9824HF	8	6.3
テンシオフィックス N9811HF		2.7
ブチレン炭酸塩	10	
炭酸プロピレン		3
芳香族 200ND	全容積 100ml に対するバランス	全容積 100ml に対するバランス

【００５１】

試料９及び１０は、その保存安定性を評価するため、５４℃及び４０℃の一定温度、並びに－１０℃／４０℃の１日サイクルを包含する種々の温度条件に曝露した。化学的アッセイを保存２週間後に測定したところ、製剤９及び１０は全ての保存条件下で活性成分の損失が検出されず、化学的に安定であることが見出された。試料はまた、レオロジー構造強度の指標として、それ故に製剤安定性の指標として公知である降伏応力に基づいて比較した。降伏応力値が高いほどゲル強度は強く、それ故に製剤安定性はより良好である。降伏応力は、４ｍｍのクロスハッチプレートを備えたＴＡ　Ｉｎｓｔｒｕｍｅｎｔｓからの ＡＲ１０００レオメーターを用いて測定した。粘度－応力曲線は、装置を使用して可能である最も低いトルクから１０，０００マイクロニュートンメートル（μＮｍ）までレオメーターを操作することにより、定常状態の剪断を行うことで得た。降伏応力を次いで、レオメーター上のソフトウェアにより、パスカル（Ｐａ）で測定される、試料を流動させる初発応力値として計算した。試料９及び１０の降伏応力測定を表５中に示す。結果は、製剤９及び１０の降伏応力値は種々の保存条件に供したときに非常に安定して高く、安定なレオロジー構造が各製剤中に存在することを指し示した。

【表４】

表５．保存後の製剤９及び１０の降伏応力測定

	初期降伏応力、Pa	２週間後の54℃での降伏応力、Pa	８週間後の40℃での降伏応力、Pa	ニ週間後の-10℃/40℃での降伏応力、Pa
製剤９	2.3	2.3	2.2	2.0
製剤10	1.8	2.3		2.1

【００５２】

特定のＯＤ製剤の注入性は、経時的に生じる沈降の量の測定値であり、保存していた容器から沈降物を注ぐのにどのくらい抵抗性があるかである。注入性値は、ＣＩＰＡＣ法ＭＴ１４８．１、Ｐｏｕｒａｂｉｌｉｔｙ ｏｆ Ｓｕｓｐｅｎｓｉｏｎ Ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅｓを使用して測定可能である。この方法においては、濃厚懸濁液を規定の時間、静置し、次いで標準化された注入手法に供する。注入後の容器中に残った物質の量を決定し、容器中に残った物質の重量％として報告する。注入後に残った物質の重量％は、注入性値として公知である。製剤１０の試料を含有するガラスボトルを室温で２４時間静置し、次いでボトルの内容物をＣＩＰＡＣ法ＭＴ１４８．１に従って注ぎ出した。注入後のボトル中に残った製剤１０の残存量は元の量の１．７７重量％であることが見出され、それによって製剤１０の注入性値１．７７％を与えた。

【００５３】

本発明は限定された数の実施形態に関して記述されているが、１の実施形態の特異的な特色を、本発明の他の実施形態に帰するべきではない。単一の実施形態は、本発明の全ての態様を代表するものではない。いくつかの実施形態において、組成物又は方法は、本明細書において言及されていない多数の化合物又は工程を包含することができる。他の実施形態において、組成物又は方法は、本明細書において列挙されていない化合物又は工程を何ら包含しない又は実質的に含まない。記述された実施形態からの変形及び改変が存在する。最後に、本明細書において開示されているあらゆる数は、数を記述するのに語「約（about）」又は「およそ（approximately）」が用いられるかどうかにかかわらず、おおよその値を意味するものと解釈するべきである。添付される実施形態及び特許請求の範囲は、本発明の範囲内に入る全ての改変及び変形に及ぶことを意図する。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 11/24457

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC(8) - A01N 43/68 (2011.01)
USPC - 504/234
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)
USPC - 504/234 (see search terms below)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
USPC - 504/342; 504/360 (see search terms below)

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
USPTO-WEST - PGPB,USPT,USOC,EPAB,JPAB keywords: fungicidal composition, dispersed in water, emulsifiers, surfactants, wetting, combinations, herbicides, insecticides, fungicides, pyroxsulam, diflufenican, fluroxypyr, bromoxynil, dicamba, MCPA, treatment, plant, applied, roots, seeds, dibenzylidene sorbitol, herbicide safeners, benoxacor, thickening

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2011/017547 A1 (BOEBEL et al.) 10 February 2011 (10.02.2011), para [0004]; [0043] - [0044]; [0046] - [0048]; [0050] - [0052]; [0055]; [0058] - [0061].	1-18
Y	The Federal Register, Vol 75(3), Rules and Regulations, 40 CFR Part 180, Dibenzylidene Sorbitol; Exemption from the Requirement of a Tolerance, pp 763 - pp 767, 06 January 2010, pg 766. edocket.access.gpo.gov/2010/pdf/E9-31281.pdf	1-18
Y	WO 2011/017480 A2 (EHR et al.) 10 February 2011 (10.02.2011), para [0012]; [0039]; [0061] - [0063]; [0065] - [0067].	3-4, 13-14 and 16

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐

* 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
"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)
"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	Date of mailing of the international search report
28 March 2011 (28.03.2011)	13 APR 2011
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. 571-273-3201	Authorized officer: Lee W. Young PCT Helpdesk: 571-272-4300 PCT OSP: 571-272-7774

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2009)

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
Ａ０１Ｎ 43/42	*(2006.01)*	Ａ０１Ｎ	43/42 １０１	
Ａ０１Ｐ 3/00	*(2006.01)*	Ａ０１Ｐ	3/00	
Ａ０１Ｐ 7/04	*(2006.01)*	Ａ０１Ｐ	7/04	
Ａ０１Ｐ 13/00	*(2006.01)*	Ａ０１Ｐ	13/00	

(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,RS,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,ID,IL,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

(72)発明者 ホプキンズ，デリク
ニュージーランド国 ４３１２，ニュー プリマス，マンゴレイ ロード ５０３
(72)発明者 キニー，フランクリン
アメリカ合衆国 インディアナ州 ４６０３３，カーメル，ウィンザー ドライブ １２３０４
(72)発明者 リュー，レイ
アメリカ合衆国 インディアナ州 ４６０３２，カーメル，ブルックミル コート １５０１
(72)発明者 チン，クイデ
アメリカ合衆国 インディアナ州 ４６０７４，ウェストフィールド，ラマナ プレイス １３１７９

Ｆターム(参考) 4H011 AA01 AB01 AC01 BA04 BB09 BB11 BC08 DA15 DG16