

(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2007-508340

(P2007-508340A)

(43) 公表日 平成19年4月5日(2007.4.5)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
AO 1 N 43/90 (2006.01)	AO 1 N 43/90 1 O 5	2 B O 5 1
AO 1 N 37/46 (2006.01)	AO 1 N 37/46	2 B 1 2 1
AO 1 N 25/08 (2006.01)	AO 1 N 25/08	4 H O 1 1
AO 1 N 25/02 (2006.01)	AO 1 N 25/02	
AO 1 P 3/00 (2006.01)	AO 1 P 3/00	
審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 18 頁) 最終頁に続く		

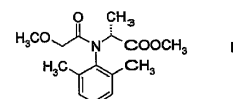
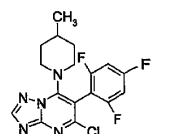
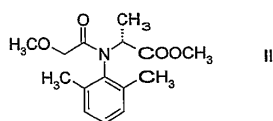
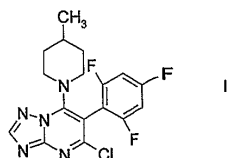
(21) 出願番号	特願2006-534651 (P2006-534651)	(71) 出願人	595123069
(86) (22) 出願日	平成16年10月8日 (2004.10.8)		ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成18年5月22日 (2006.5.22)		BASF Aktiengesellschaft
(86) 国際出願番号	PCT/EP2004/011256		ドイツ連邦共和国 デー-67056 ルートビシヤフェン (番地なし)
(87) 国際公開番号	W02005/036964		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(87) 国際公開日	平成17年4月28日 (2005.4.28)	(74) 代理人	100091096
(31) 優先権主張番号	10349058.2		弁理士 平木 祐輔
(32) 優先日	平成15年10月17日 (2003.10.17)	(74) 代理人	100096183
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)		弁理士 石井 貞次
		(74) 代理人	100118773
			弁理士 藤田 節
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 イネ病原体を防除するための殺菌混合物

(57) 【要約】

本発明はイネ病原体を防除するための殺菌混合物に関する。前記混合物は活性成分として、1)式(I)のトリアゾロピリミジン誘導体、および2)式(II)のメタラキシル-Mを相乗効果を有する量で含む。本発明はまた、化合物(I)と化合物(II)との混合物を使用してイネ病原体を防除する方法、該混合物を製造するための化合物(I)および化合物(II)の使用、ならびに該混合物を含有する薬剤に関する。

【選択図】 なし

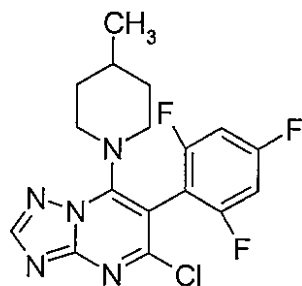


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

1) 式 I

【化 1】



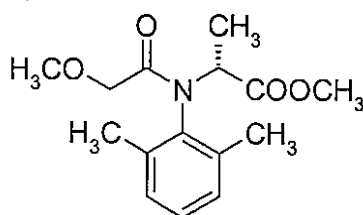
I

10

のトリアゾロピリミジン誘導体、および

2) 式 II

【化 2】



II

20

のメタラキシル-Mを、相乗効果を有する量で含む、イネ病原体を防除するための殺菌混合物。

【請求項 2】

式 I の化合物および式 II の化合物を 100:1 ~ 1:100 の重量比で含む、請求項 1 に記載の殺菌混合物。

【請求項 3】

液体または固体の担体および請求項 1 または 2 に記載の混合物を含む殺菌組成物。

【請求項 4】

イネ病原性の有害な菌類を防除する方法であって、菌類、その生育環境または菌類の攻撃から保護すべき植物、土壌もしくは種子を、有効量の請求項 1 に記載の化合物 I および化合物 II により処理することを含む、前記方法。

30

【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物 I および II を同時に、すなわち一緒にもしくは別々に、または連続して施用する、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

請求項 1 または 2 に記載の混合物を、5 g/ha ~ 2000 g/ha の量で施用する、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 7】

有害な菌類であるイモチ病菌 (*Pyricularia oryzae*) を防除する、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

40

【請求項 8】

請求項 1 または 2 に記載の混合物を、1 ~ 1000 g/種子 100 kg の量で施用する、請求項 4 または 5 に記載の方法。

【請求項 9】

1 ~ 1000 g/100 kg の量の請求項 1 または 2 に記載の混合物を含む種子。

【請求項 10】

イネ病原性の有害な菌類を防除するのに適した組成物を調製するための、請求項 1 に記載の化合物 I および II の使用。

50

【発明の詳細な説明】

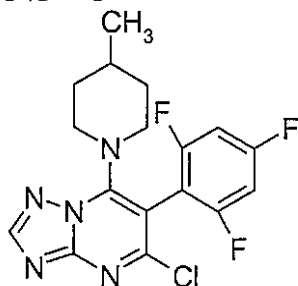
【技術分野】

【0001】

本発明は、活性成分として、

1) 式 I

【化 1】



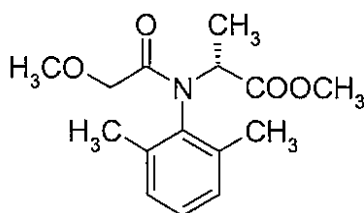
10

【0002】

のトリアゾロピリミジン誘導体、および

2) 式 II

【化 2】



20

【0003】

のメタラキシル-Mを、相乗効果を有する量で含む、イネ病原体を防除するための殺菌混合物に関する。

【0004】

さらに、本発明は、化合物Iと化合物IIとの混合物を使用してイネ病原体を防除する方法、かかる混合物を調製するための化合物Iと化合物IIの使用、およびこれらの混合物を含む組成物に関する。

30

【背景技術】

【0005】

化合物I、5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、その調製およびその有害な菌類に対する作用は文献により公知である(WO 98/46607)。

【0006】

化合物II、メチルN-(メトキシアセチル)-N-(2,6-キシリル)-D-アラニネート、その調製およびその有害な菌類に対する作用も同様に文献により公知である(WO 96/01559、一般名：メタラキシル-M、また、しばしばメフェノキサムとも呼ばれる)。それは、卵菌類(Oomycetes)に対する農業用殺菌剤として確立されている。

40

【0007】

トリアゾロピリミジン誘導体とメタラキシルとの混合物は、EP-A 988 790により一般的な形で公知である。一般名「メタラキシル」は、式IIのアシルアラニン誘導体および対応するL-異性体の混合物を指す。化合物Iはこの文献の一般的な開示に含まれているものの、明記はされていない。化合物IとD-異性体であるメタラキシル-Mとの組合せは新規である。

【0008】

EP-A 988 790により公知の相乗性混合物は、穀類、果実および野菜の種々の病気、例え

50

ばコムギおよびオオムギのうどん粉病またはリンゴの灰色カビ病に対して殺菌活性を示すと記載されている。

【0009】

本発明の目的は、できる限り少ない施量でイネ病原体を効果的に防除することを目的として、活性化合物の総量を減らしつつ、イネ病原体に対する改善された効果を有する混合物を提供することである。

【0010】

イネ植物の特殊な栽培条件のため、イネ殺菌剤が満たすべき要件は、穀類または果実の栽培時に使用される殺菌剤が満たすべき要件とはかなり異なる。施用方法が相違する。つまり、現代のイネ栽培においては、多くの地域で通常行われている葉への施用に加えて、殺菌剤を種蒔きの最中または直後に直接土壌に施用する。殺菌剤は根から植物に取り込まれ、該植物の樹液を介して保護すべき植物部位に運ばれる。一方、穀類および果実の栽培時には、殺菌剤を通常は葉または果実に施用する。従って、これらの作物では、活性化合物の浸透作用は殆ど重要とされない。

10

【0011】

さらに、イネ病原体は、一般的に穀類または果実の病原体と異なる。イネのイモチ病菌 (*Pyricularia oryzae*) およびコルチシウム・ササキイ (*Corticium sasakii*) (異名: リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*)) は、イネ植物に最もよく見られる病気の病原体である。リゾクトニア・ソラニは、サブクラスであるアガリコミセチダエ (*Agaricomycetidae*) に属する、農業的意義を有する唯一の病原体である。大部分の他の菌類とは対照的に、この菌は孢子ではなく菌糸体による感染を介して植物を攻撃する。

20

【0012】

このため、穀類または果実栽培時の殺菌活性に関する知見をイネ作物に当てはめることはできない。

【発明の開示】

【0013】

本発明の目的は、できる限り少ない施量でイネ病原体を効果的に防除することを目的として、活性化合物の総量を減らしつつ、有害な菌類に対する改善された効果を有する混合物を提供することである。

【0014】

本発明者らは、上記で定義した混合物によりこの目的が達成されることを見出した。驚くべきことに、上記で定義したメタラキシル-M混合物により、EP-A 988 790に開示されたトリアゾロピリミジン化合物のメタラキシル-Mとの混合物よりもかなり優れたイネ病原体の防除が可能となることが見出された。さらに、本発明者らは、化合物Iおよび化合物IIを同時に、すなわち一緒にもしくは別々に施用すること、または化合物Iおよび化合物IIを連続して施用することにより、個々の化合物を用いて達成しうる防除よりも優れたイネ病原体の防除が可能となることが見出した。

30

【0015】

前記混合物を調製する場合、純粋な活性化合物IおよびIIを使用することが好ましく、必要に応じて、有害な菌類または昆虫、クモもしくは線虫などの他の害虫に対するさらなる活性化合物、あるいは除草もしくは生長調節活性化合物または肥料を加えることができる。

40

【0016】

上記の意味で適切な他の活性化合物は、特に、下記の群：

- ・ベナラキシル (benalaxyl)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl) などのアシルアラニン、
- ・アルジモルフ (aldimorph)、ドデモルフ (dodemorph)、フェンプロピジン (fenpropidin)、グアザチン (guazatine)、イミノクタジン (iminoctadine)、トリデモルフ (tridemorph) などのアミン誘導体、
- ・シクロヘキシミド (cycloheximid)、グリセオフルビン (griseofulvin)、カスガマイ

50

シン (kasugamycin)、ナタマイシン (natamycin)、ポリオキシシン (polyoxin) またはストレプトマイシン (streptomycin) などの抗生物質、

・ビテルタノール (bitertanol)、プロモコナゾール (bromoconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジニトロコナゾール (dinitroconazole)、エニルコナゾール (enilconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホル (flutriafol)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、イマザリル (imazalil)、イブコナゾール (ipconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ペンコナゾール (penconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、シメコナゾール (simeconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリフルミゾール (triflumizol)、トリチコナゾール (triticonazole) などのアゾール、

10

・ミクロゾリン (myclozolin)、プロシミドン (procymidone) などのジカルボキシミド、

・フェルバム (ferbam)、ナバム (nabam)、メタム (metam)、プロピネブ (propineb)、ポリカルバメート (polycarbamate)、ジラム (ziram)、ジネブ (zineb) などのジチオカルバメート、

・アニラジン (anilazine)、ボスカリド (boscalid)、カルベンダジム (carbendazim)、カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、シアゾファミド (ciazofamid)、ダゾメット (dazomet)、ファモキサドン (famoxadon)、フェンアミドン (fenamidon)、フベリダゾール (fuberidazole)、フルトラニル (flutolanil)、フラメトピル (furametpyr)、イソプロチオラン (isoprothiolan)、メプロニル (mepronil)、ヌアリモール (nuarimol)、プロベナゾール (probenazole)、ピロキロン (pyroquilon)、シルチオフアム (silthiofam)、チアベンダゾール (thiabendazol)、チフルザミド (thifluzamid)、チアジニル (tiadinil)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリフォリン (triforine) などの複素環式化合物、

20

・ビナバクリル (binapacryl)、ジノカップ (dinocap)、ジノブトン (dinobuton)、ニトロフタル-イソプロピル (nitrophthal-isopropyl) などのニトロフェニル誘導体、

・フェンピクロニル (fenpiclonil) またはフルジオキシニル (fludioxonil) などのフェニルピロール、

30

・アシベンゾラル-S-メチル (acibenzolar-S-methyl)、カルプロパミド (carpropamid)、クロロタロニル (chlorothalonil)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、シモキサニル (cymoxanil)、ジクロメジン (diclomezin)、ジクロシメット (diclocymet)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、エジフェンホス (edifenphos)、エタボキサム (ethaboxam)、酢酸フェンチン (fentin-acetate)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フォセチル (fosetyl)、ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene)、メトラフェノン (metrafenone)、ペンシクロン (pencycuron)、プロパモカルブ (propamocarb)、フタリド (phthalide)、トルクロフォス-メチル (toloclofos-methyl)、キントゼン (quintozene)、ゾキサミド (zoxamid) などの他の殺菌剤、

40

・フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、メトミノストロビン (metominostrobin)、オリサストロビン (orysastrobin) またはピラクロストロビン (pyraclostrobin) などのストロビルリン、

・キャプタホル (captafol) などのスルフェン酸誘導体、

・フルメトベル (flumetover) などのシンナミドおよび類似化合物

から選択される殺菌剤である。

【0017】

本発明の混合物の一実施形態では、もう1種の殺菌剤IIIまたは2種の殺菌剤IIIおよびIVを化合物IおよびIIに加える。化合物IおよびIIと成分IIIとの混合物が好ましい。特に好ましいのは、化合物IおよびIIの混合物である。

50

【 0 0 1 8 】

化合物IおよびIIの混合物、または同時に、すなわち一緒にもしくは別々に使用される化合物IおよびIIは、子囊菌類(Ascomycetes)、不完全菌類(Deuteromycetes)および担子菌類(Basidiomycetes)のクラスに属するイネ病原体に対する際立った作用を呈する。それらは、種子を処理する場合に、また葉および土壌に作用する殺菌剤として、使用することができる。

【 0 0 1 9 】

それらは、イネ植物および該植物の種子においてビポラリス(Bipolaris)およびドレクスレラ(Drechslera)sp.、ならびにイモチ病菌(Pyricularia oryzae)などの有害な菌類を防除する際に特に重要である。それらはイモチ病菌により引き起こされるイネのイモチ病を防除するのに特に適している。 10

【 0 0 2 0 】

さらに、本発明の化合物IおよびIIの組合せは、例えば、穀類におけるセプトリア(Septoria)およびブクキニア(Puccinia)sp.、ならびに野菜、果実およびブドウにおけるアルタナリア(Alternaria)およびボトリティス(Botrytis)sp.などの他の病原体を防除するためにも使用できる。

【 0 0 2 1 】

化合物Iおよび化合物IIは、同時に、すなわち一緒にもしくは別々に、または連続して施用することが可能であり、別々の施用の場合、その順番は、一般的に防除手段の結果に何の影響も与えない。 20

【 0 0 2 2 】

化合物Iおよび化合物IIは、通常は100:1~1:100、好ましくは20:1~1:20、特に5:1~1:5の重量比で施用される。

【 0 0 2 3 】

成分IIIおよび好適な場合には成分IVは、必要に応じて、20:1~1:20の重量比で化合物Iに加える。

【 0 0 2 4 】

化合物のタイプおよび要求される効果に応じて、本発明の混合物の施量は、5 g/ha~2000 g/ha、好ましくは50~1500 g/ha、特に50~750 g/haである。

【 0 0 2 5 】

同様に、化合物Iの施量は、一般的に1~1000 g/ha、好ましくは10~750 g/ha、特に20~500 g/haである。 30

【 0 0 2 6 】

同様に、化合物IIの施量は、一般的に1~1000 g/ha、好ましくは10~750 g/ha、特に20~500 g/haである。

【 0 0 2 7 】

種子の処理においては、混合物の施量は、一般的に1~1000 g/種子100 kg、好ましくは1~750 g/100 kg、特に5~500 g/100 kgである。

【 0 0 2 8 】

イネ植物に対して病原性を持つ有害な菌類の防除において、化合物IとIIとの混合物の施用、または化合物IおよびIIの別々のまたは一緒にの施用は、植物の種蒔きの前もしくは後、または植物の発芽の前もしくは後に、種子、苗、植物または土壌に噴霧または散粉することにより実施される。化合物IおよびIIは好ましくは葉に噴霧することにより施用する。これらの化合物の施用は、顆粒を施用することによりまたは土壌に散粉することにより実施してもよい。 40

【 0 0 2 9 】

本発明の混合物または化合物IおよびIIは、通常の製剤、たとえば、溶液、エマルジョン、懸濁液、粉末、ダスト、ペーストおよび顆粒に変換することができる。施用剤形は個々の目的に依存するが、いずれの場合にも、それは本発明の化合物の微細で均一な分布を保証するものでなければならない。 50

【0030】

製剤は公知の方法、たとえば、活性化合物を溶媒および/または担体により、所望により乳化剤および分散剤を用いて希釈することにより調製される。好適な溶媒/添加剤は基本的に次の通りである。

【0031】

- 水、芳香族溶媒（たとえば、ソルベッソ(Solvesso)製品、キシレン）、パラフィン（たとえば、鉱油留分）、アルコール（たとえば、メタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール）、ケトン（たとえば、シクロヘキサノン、ガンマ-ブチロラクトン）、ピロリドン（NMP、NOP）、酢酸エステル（二酢酸グリコール）、グリコール、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸および脂肪酸エステル。原則として、溶媒混合物も用いることができる。

10

【0032】

- 粉碎した天然鉱物（たとえば、カオリン、クレー、タルク、チョーク）および粉碎した合成鉱物（たとえば、高分散シリカ、ケイ酸塩）などの担体；非イオンおよび陰イオン乳化剤（たとえば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホネートおよびアリアルスルホネート）などの乳化剤；およびリグニン亜硫酸廃液およびメチルセルロースなどの分散剤。

【0033】

好適な界面活性剤は、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、アルキルアリアルスルホネート、アルキルスルフェート、アルキルスルホネート、脂肪アルコールスルフェート、脂肪酸および硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテルのアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩およびアンモニウム塩である。さらに、スルホン化ナフタレンおよびナフタレン誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアリルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、アルコールおよび脂肪アルコール/エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ひまし油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、ソルビトールエステル、リグニン亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。

20

30

【0034】

直接噴霧可能な溶液、エマルション、ペーストまたは油分散物の調製に適している物質は、ケロシンまたはジゼル油などの中程度から高い沸点の鉱油留分、さらに、コールタール油および植物または動物由来の油、脂肪族、環式および芳香族炭化水素、たとえば、トルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンまたはその誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、極性の高い溶媒、たとえば、ジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン、または水である。

40

【0035】

粉末、散布用材料および散粉剤は、活性物質を固体の担体と混合または同時に粉碎することにより調製することができる。

【0036】

顆粒、たとえば、被覆顆粒、含浸顆粒および均一な顆粒は、活性化合物を固体の担体に結合させることにより調製することができる。固体の担体の例は、シリカゲル、ケイ酸塩、タルク、カオリン、アタクレイ(attaclay)、石灰岩、石灰、チョーク、膠塊粘土、黄土、クレー、白雲石、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなどの鉱物土類、粉碎した合成材料、たとえば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素などの肥料、および穀物粗挽き粉、樹皮粗挽き粉、木材粗挽き粉およ

50

び木の実の殻の粗挽き粉などの植物由来の製品、セルロース粉末および他の固体の担体である。

【0037】

一般的に、製剤は、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%の活性化合物を含む。活性化合物は、90%~100%、好ましくは95%~100%の純度(NMRスペクトルによる)のものを使用する。

【0038】

以下に製剤の例を示す。

【0039】

1. 水により希釈するための製品

10

A) 水溶性濃縮物(SL)

10重量部の活性化合物を水または水溶性溶媒に溶解する。あるいは、湿潤剤または他の添加剤を加える。活性化合物は水により希釈すると溶解する。

【0040】

B) 分散性濃縮物(DC)

20重量部の活性化合物を、分散剤、たとえばポリビニルピロリドンを加えてシクロヘキサノンに溶解する。水により希釈すると分散物が得られる。

【0041】

C) 乳化性濃縮物(EC)

15重量部の活性化合物を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびエトキシ化ひまし油(それぞれ濃度5%)を加えてキシレンに溶解する。水により希釈するとエマルションが得られる。

20

【0042】

D) エマルション(EW、EO)

40重量部の活性化合物をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびエトキシ化ひまし油(それぞれ濃度5%)を加えてキシレンに溶解する。この混合物を乳化器(Ultraturrax)を用いて水中に導入し、均一なエマルションを調製する。水により希釈するとエマルションが得られる。

【0043】

E) 懸濁液(SC、OD)

30

攪拌したボールミル中で、20重量部の活性化合物を、分散剤、湿潤剤および水または有機溶媒を加えて粉碎すると、微細な活性化合物の懸濁液が得られる。水により希釈すると、活性化合物の安定な懸濁液が得られる。

【0044】

F) 水分散性顆粒および水溶性顆粒(WG、SG)

50重量部の活性化合物を、分散剤および湿潤剤を加えて微細に粉碎し、技術機器(たとえば、射出機、噴霧塔、流動床)を用いて水分散性または水溶性顆粒を調製する。水により希釈すると活性化合物の安定な分散物または溶液が得られる。

【0045】

G) 水分散性粉末および水溶性粉末(WP、SP)

40

75重量部の活性化合物を、分散剤、湿潤剤およびシリカゲルを加えてローターステーターミル(rotor-stator mill)中で粉碎する。水により希釈すると活性化合物の安定な分散物または溶液が得られる。

【0046】

2. 希釈せずに施用する製品

H) 散粉剤(DP)

5重量部の活性化合物を微細に粉碎し、95%の微細に粉碎したカオリンと緊密に混合する。これにより散粉剤が得られる。

【0047】

I) 顆粒(GR、FG、GG、MG)

50

0.5重量部の活性化合物を微細に粉碎し、95.5%の担体と結合させる。最新の方法は射出、噴霧乾燥または流動床である。これにより希釈せずに施用される顆粒が得られる。

【0048】

J) ULV溶液(UL)

10重量部の活性化合物を有機溶媒、たとえばキシレンに溶解する。これにより希釈せずに施用される製品が得られる。

【0049】

活性化合物は、そのまま、それらの製剤の形で、またはその製剤から調製された使用形態で、たとえば、直接噴霧できる溶液、粉末、懸濁液もしくは分散液、エマルション、油分散物、ペースト、散粉剤、散布用材料、または顆粒の形で、スプレー、噴霧、散粉、散布または注入により使用することができる。使用形態は意図される目的に完全に依存するが、いずれの場合にも、それらは本発明の活性化合物の可能な限り微細な分布を保証することを目的とするものである。

10

【0050】

水性の使用形態は、濃縮エマルション、ペーストまたは湿潤性粉末(噴霧用粉末、油分散物)に水を加えることにより調製することができる。エマルション、ペーストまたは油分散物を調製するために、物質を、そのまま、または油または溶媒に溶解して、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤を用いて水中に均一化することができる。あるいは、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤、および適切な場合には溶媒または油を含む濃縮物を調製することができ、このような濃縮物は水による希釈に適している。

20

【0051】

そのまま使える製剤における活性化合物濃度は比較的広い範囲内で変化し得る。一般的に、上記濃度は0.0001~10%、好ましくは0.01~1%である。

【0052】

活性化合物は、95重量%以上の活性化合物を含む製剤を施用することが可能な、または添加剤を含まない活性化合物を施用することさえも可能な微量散布法(ULV)にも効果的に使用することができる。

【0053】

さまざまなタイプの油、湿潤剤、補助剤、除草剤、殺菌剤(fungicides)、他の殺虫剤または殺菌剤(bactericides)を、適切な場合には使用の直前に、活性化合物に加えることができる(タンクミックス)。これらの薬剤は本発明の薬剤に、通常1:10~10:1の重量比で混合することができる。

30

【0054】

化合物IおよびIIもしくは混合物または対応する製剤は、有害な菌類またはそれらから保護すべき植物、種子、土壌、領域、材料もしくは空間を、混合物、または別々の施用の場合には化合物IおよびIIの殺菌に有効な量により処理することにより施用される。施用は、有害な菌類の感染の前または後に実施することができる。

【0055】

化合物および混合物の殺菌作用は下記の実験により証明することができる。

【実施例】

40

【0056】

活性化合物を、別々にまたは一緒に、アセトンまたはDMSO中に0.25重量%の活性化合物を含む原液として調製した。1重量%の乳化剤Uniperol(登録商標)EL(エトキシ化アルキルフェノールをベースとする乳化および分散作用を有する湿潤剤)をこの溶液に加えて、上記溶液を水により所望の濃度に希釈した。

【0057】

使用例 - イモチ病菌(Pyricularia oryzae)により引き起こされるイネのイモチ病に対する保護活性

植木鉢で栽培された品種「Tai-Nong 67」のイネの苗の葉に、下記の濃度の活性化合物を有する水性懸濁液を流出点まで噴霧した。翌日、植物にイモチ病菌の水性孢子懸濁液を

50

接種した。次に、試験植物を22～24℃でかつ95～99%の相対大気湿度の気候調節室に6日間置いた。次に、葉における感染の発達の程度を視覚的に測定した。

【0058】

評価は、感染した葉の面積をパーセントで測定することにより実施した。これらのパーセンテージを効果に変換した。

【0059】

効果(E)は、下記のようにアボット(Abbot)の式を用いて算出する：

$$E = (1 - \alpha / \beta) \cdot 100$$

α は、%で表した処理された植物の菌類感染に対応し、また

β は、%で表した未処理(対照)の植物の菌類感染に対応する。

10

【0060】

効果0は、処理された植物の感染レベルが未処理の対照植物の感染レベルと一致することを意味しており、また効果100は、処理された植物が感染していないことを意味する。

【0061】

活性化合物の混合物について予想される効果をコルビー(Colby)の式(R.S.Colby, Weeds 15, 20-22(1967))を用いて決定し、観察された効果と比較する。

【0062】

コルビーの式：

$$E = x + y - x \cdot y / 100$$

E 濃度aおよびbの活性化合物AおよびBの混合物を用いた場合の、未処理の対照に対する%で表された予想される効果

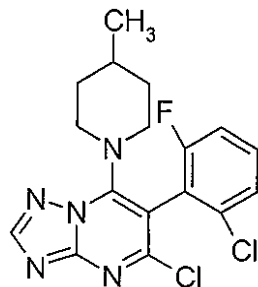
20

x 濃度aの活性化合物Aを用いた場合の、未処理の対照に対する%で表された効果

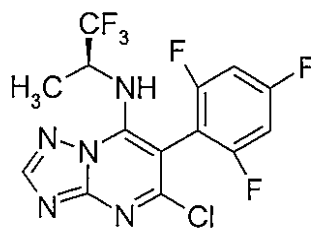
y 濃度bの活性化合物Bを用いた場合の、未処理の対照に対する%で表された効果

使用した比較用化合物は、EP-A 988 790に記載のメタラキシル混合物により公知の化合物AおよびBである。

【化3】



A



B

30

【表 1】

表 A—個々の活性化合物

使用例	活性化合物	噴霧液中の活性化合物 の濃度 [ppm]	未処理の対照に対する % で表された効果
1	対照 (未処理)	—	(84% 感染)
2	I	4	28
		1	16
3	II (メタラキシル-M)	4	0
4	比較用化合物 A	4	4
		1	0
5	比較用化合物 B	4	40
		1	4

10

表 B—本発明の混合物

使用例	活性化合物の混合物 濃度 混合比	観察された効果	算出された効果*)
6	I + II	76	28
	4 + 4 ppm 1:1		
7	I + IIa	76	16
	1 + 4 ppm 1:4		

20

30

*) コルビーの式を用いて算出された効果

【 0 0 6 3 】

表 C - 比較試験

EP-A 988 790 により公知の比較用化合物メタラキシル-M 混合物

使用例	活性化合物の混合物 濃度 混合比	観察された効果	算出された効果*)
8	A + II 4 + 4 ppm 1:1	16	4
9	A + II 1 + 4 ppm 1:4	0	0
10	B + II 4 + 4 ppm 1:1	40	40
11	B + II 1 + 4 ppm 1:4	28	4

*) コルビーの式を用いて算出された効果

【 0 0 6 4 】

試験結果から、本発明の混合物は、強い相乗効果により、イネのイモチ病に対して、比較用化合物である EP-A 988 790 により公知のメタラキシル-M 混合物よりかなり有効であることが分かる。

【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 平成 18 年 5 月 25 日 (2006.5.25)

【 手 続 補 正 1 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 特 許 請 求 の 範 囲

【 補 正 対 象 項 目 名 】 全 文

【 補 正 方 法 】 変 更

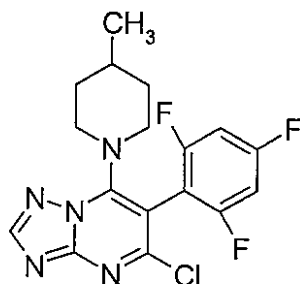
【 補 正 の 内 容 】

【 特 許 請 求 の 範 囲 】

【 請 求 項 1 】

1) 式 I

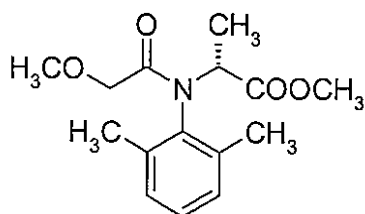
【 化 1 】



のトリアゾロピリミジン誘導体、および

2) 式 II

【化 2】



II

のメタラキシル-Mを、相乗効果を有する量で含む殺菌混合物。

【請求項 2】

式 I の化合物および式 II の化合物を 100:1 ~ 1:100 の重量比で含む、請求項 1 に記載の殺菌混合物。

【請求項 3】

液体または固体の担体および請求項 1 または 2 に記載の混合物を含む殺菌組成物。

【請求項 4】

イネ病原性の有害な菌類を防除する方法であって、菌類、その生育環境または菌類の攻撃から保護すべき植物、土壌もしくは種子を、有効量の請求項 1 に記載の化合物 I および化合物 II により処理することを含む、前記方法。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物 I および II を同時に、すなわち一緒にもしくは別々に、または連続して施用する、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

請求項 1 または 2 に記載の混合物を、5 g/ha ~ 2000 g/ha の量で施用する、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 7】

有害な菌類であるイモチ病菌 (*Pyricularia oryzae*) を防除する、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 8】

請求項 1 または 2 に記載の混合物を、1 ~ 1000 g/種子 100 kg の量で施用する、請求項 4 または 5 に記載の方法。

【請求項 9】

1 ~ 1000 g/100 kg の量の請求項 1 または 2 に記載の混合物を含む種子。

【請求項 10】

請求項 3 に記載の殺菌組成物を調製するための、請求項 1 に記載の化合物 I および II の使用。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
P04/EP2004/011256

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A01N43/90 //(A01N43/90, 37:46)		
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) IPC 7 A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 988 790 A (AMERICAN CYANAMID CO) 29 March 2000 (2000-03-29) cited in the application claim 1	
A	WO 98/46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application example 2	
☐ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in 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 document 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. *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
9 December 2004		22/12/2004
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Bertrand, F

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/011256

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0988790	A	29-03-2000	AT 240648 T	15-06-2003
			DE 69908052 D1	26-06-2003
			DE 69908052 T2	27-11-2003
			DK 988790 T3	22-09-2003
			EP 0988790 A1	29-03-2000
			ES 2203021 T3	01-04-2004
			PT 988790 T	31-10-2003
			SI 988790 T1	31-10-2003
WO 9846607	A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
			AU 6576898 A	11-11-1998
			DE 69801048 D1	09-08-2001
			DE 69801048 T2	14-03-2002
			DK 975634 T3	24-09-2001
			EP 0975634 A1	02-02-2000
			ES 2160408 T3	01-11-2001
			GR 3036714 T3	31-12-2001
			PT 975634 T	28-12-2001
			WO 9846607 A1	22-10-1998
			ZA 9803055 A	11-10-1999

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/011256

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 A01N43/90 //(A01N43/90,37:46)		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 988 790 A (AMERICAN CYANAMID CO) 29. März 2000 (2000-03-29) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1	
A	WO 98/46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Beispiel 2	
☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist. *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
9. Dezember 2004		22/12/2004
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2200 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 661 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Bertrand, F

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/011256

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0988790 A	29-03-2000	AT 240648 T	15-06-2003
		DE 69908052 D1	26-06-2003
		DE 69908052 T2	27-11-2003
		DK 988790 T3	22-09-2003
		EP 0988790 A1	29-03-2000
		ES 2203021 T3	01-04-2004
		PT 988790 T	31-10-2003
		SI 988790 T1	31-10-2003
WO 9846607 A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
		AU 6576898 A	11-11-1998
		DE 69801048 D1	09-08-2001
		DE 69801048 T2	14-03-2002
		DK 975634 T3	24-09-2001
		EP 0975634 A1	02-02-2000
		ES 2160408 T3	01-11-2001
		GR 3036714 T3	31-12-2001
		PT 975634 T	28-12-2001
		WO 9846607 A1	22-10-1998
		ZA 9803055 A	11-10-1999

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード(参考)
A 0 1 M 99/00 (2006.01)		A 0 1 M 99/00	
A 0 1 C 1/08 (2006.01)		A 0 1 C 1/08	

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

(74)代理人 100125508

弁理士 藤井 愛

(72)発明者 トルモ イー プラスコ, ヨールディ

ドイツ連邦共和国 6 9 5 1 4 ラウデンバッハ, カール - ベンツ - シュトラッセ 1 0 - 3

(72)発明者 グローテ, トーマス

ドイツ連邦共和国 6 7 1 5 7 ヴァッヘンハイム, イム ヘーエンハウゼン 1 8

(72)発明者 シェラー, マリア

ドイツ連邦共和国 7 6 8 2 9 ゴッドラムシュタイン, ヘルマン - ユールゲンス - シュトラッセ 3 0

(72)発明者 スティール, ラインハルト

ドイツ連邦共和国 6 7 2 5 1 フラインスハイム, ヤーンシュトラッセ 8

(72)発明者 ストラトマン, ジーグフリード

ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, ドナーズベルクシュトラッセ 9

(72)発明者 シェーフル, ウルリッヒ

ドイツ連邦共和国 6 8 7 8 2 ブリュール, アルレンシュトラッセ 8

F ターム(参考) 2B051 AA01 AB01 BA09 BB01

2B121 AA20 CC04 CC28 CC31 EA25 EA26

4H011 AA01 BA06 BB06 BB09 BC01 BC05 BC07 BC10 BC18 DA02

DA15 DA16 DD03