

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4680189号
(P4680189)

(45) 発行日 平成23年5月11日(2011.5.11)

(24) 登録日 平成23年2月10日(2011.2.10)

(51) Int.Cl.

AO1N 43/88 (2006.01)
AO1N 43/653 (2006.01)
AO1N 25/30 (2006.01)
AO1P 3/00 (2006.01)

F 1

AO1N 43/88
 AO1N 43/653 Q
 AO1N 43/653 C
 AO1N 25/30
 AO1P 3/00

請求項の数 6 (全 9 頁)

(21) 出願番号 特願2006-521464 (P2006-521464)
 (86) (22) 出願日 平成16年7月19日 (2004.7.19)
 (65) 公表番号 特表2007-500153 (P2007-500153A)
 (43) 公表日 平成19年1月11日 (2007.1.11)
 (86) 國際出願番号 PCT/EP2004/008040
 (87) 國際公開番号 WO2005/011379
 (87) 國際公開日 平成17年2月10日 (2005.2.10)
 審査請求日 平成19年4月23日 (2007.4.23)
 (31) 優先権主張番号 10335183.3
 (32) 優先日 平成15年7月30日 (2003.7.30)
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

(73) 特許権者 302063961
 バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシヤフト
 ドイツ40789モンハイム・アルフレー
 トーノベルーシュトラーセ50
 (74) 代理人 100062007
 弁理士 川口 義雄
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100103920
 弁理士 大崎 勝真
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

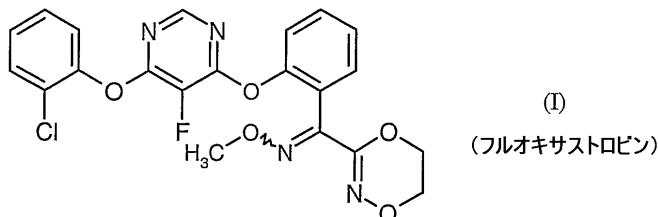
(54) 【発明の名称】殺真菌性三元活性成分組み合わせ

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

【化1】

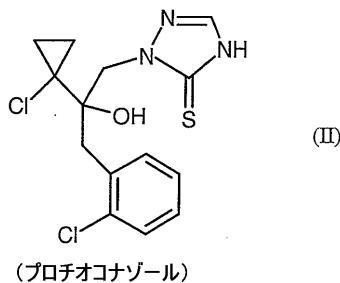


10

および

(1) 式(II)の化合物

【化2】

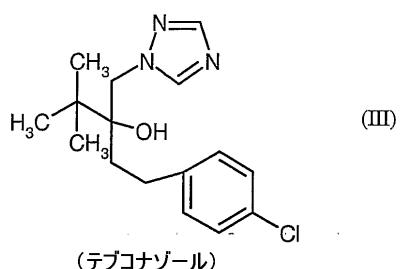


10

および

(2) 式 (I I I) の化合物

【化3】



20

を含み、式 (I) の活性化合物の式 (I I) の活性化合物に対する重量比が 1 : 0 . 1 から 1 : 1 0 であり、および式 (I I I) の活性化合物に対する重量比が 1 : 0 . 0 5 から 1 : 1 0 である

ことを特徴とする殺真菌組成物。

【請求項2】

式 (I) の活性化合物の

式 (I I) の活性化合物に対する重量比が 1 : 0 . 2 から 1 : 5 であり、および

式 (I I I) の活性化合物に対する重量比が 1 : 0 . 1 から 1 : 5 である。30
ことを特徴とする、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

請求項1に記載の組成物を真菌に、これらの生息地にまたはこれらが存在しない状態を保つべき植物、植物の部分、種子、土壤、領域、物質もしくは空間に作用させることを特徴とする、真菌の制御方法。

【請求項4】

請求項3に記載の方法によって処理され、且つ請求項1に記載の組成物が付着した、苗、塊茎、根茎、切断体および種子から成る群から選択される増殖物質。

【請求項5】

請求項1に記載の活性化合物の組成物の、植物病原性真菌の制御のための使用。40

【請求項6】

請求項1に記載の組成物を增量剤および/または表面活性剤と混合することを特徴とする、殺真菌組成物の調製方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、公知 3 - { 1 - [2 - (4 - < 2 - クロロフェノキシ > - 5 - フルオロピリミド - 6 - イルオキシ) フェニル] - 1 - (メトキシミノ) メチル } - 5 , 6 - ジヒドロ - 1 , 4 , 2 - ジオキサジン (フルオキサストロビン) および他の公知活性化合物からなり、植物病原性真菌の駆除に非常に適する新規の活性化合物の組み合わせに関する。50

【背景技術】

【0002】

3-[1-[2-(4-<2-クロロフェノキシ>-5-フルオロピリミド-6-イルオキシ)フェニル]-1-(メトキシミノ)メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン(フルオキサストロビン)が殺真菌特性を有することは既に公知である(E P - A - 0 882 043を参照)。この化合物の活性は良好である。しかしながら、低適用率では時折不十分である。

【0003】

さらに、多くのアゾール誘導体を真菌の制御に用いることができるることは既に公知である(Pesticide Manual、第11版(1997)、第1144頁; WO 96/16048を参照)。しかしながら、低適用率では、これらの化合物の活性は同様に常に満足のいくものではない。

10

【発明の開示】

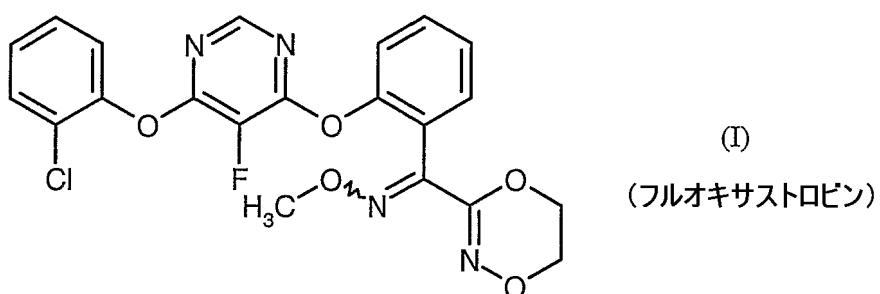
【0004】

式(I)の3-[1-[2-(4-<2-クロロフェノキシ>-5-フルオロピリミド-6-イルオキシ)フェニル]-1-(メトキシミノ)メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン(参照: DE-A-1 96 02 095)

【0005】

【化4】

20



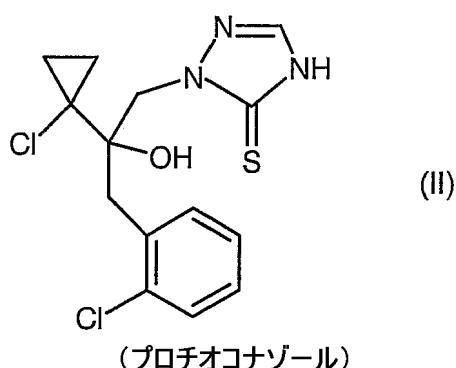
および

30

(1)式(II)の化合物(参照: WO 96/16048)

【0006】

【化5】



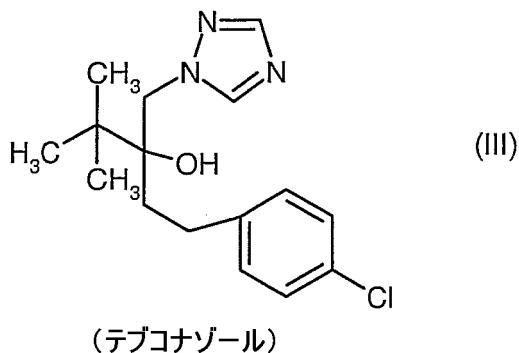
40

および

(2)式(III)の化合物(参照: E P - A - 0 040 345)

【0007】

【化6】



10

を含む新規の活性化合物の組み合わせが非常に良好な殺真菌特性を有することが今や見出されている。

【0008】

驚くべきことに、これら3種類の活性化合物を含む本発明による活性化合物の組み合わせは、個々の活性化合物の活性の合計または各々の場合において2種類の活性化合物を含む従来技術の混合物の活性を遙かに上回る。したがって、予測し得ない眞の相乗効果が存在し、単なる活性の付加ではない。

【0009】

式(I)の活性化合物は公知である(例えば、E P - A - 0 882 043を参照)。本発明による活性化合物の組み合わせ中に式(I)の活性化合物に加えて存在する式(II)および(III)の活性化合物も同様に公知である(参考文献を参照)。

20

【0010】

以下の活性化合物の組み合わせも公知である:

式(I)および(II)の化合物を含む活性化合物の組み合わせ: WO 98 / 47 367。

【0011】

式(II)および(III)の化合物を含む活性化合物の組み合わせ: WO 98 / 47367。

30

【0012】

本発明による活性化合物の組み合わせにおける活性化合物が特定の重量比で存在する場合、相乗効果が特に述べられる。しかしながら、活性化合物の組み合わせにおける活性化合物の重量比は比較的広い範囲で変化し得る。

【0013】

一般には、式(I)の活性化合物の重量部当たり、

0.1 - 1.0重量部、好ましくは、0.2 - 5重量部の式(II)の活性化合物、および

0.05 - 1.0重量部、好ましくは、0.1 - 5重量部の式(III)の活性化合物、が存在する。

40

【0014】

本発明による活性化合物の組み合わせは非常に良好な殺真菌特性を有し、植物病原性真菌、例えば、プラスモジオホロミセテス(Plasmodiophoromycetes)、オオミセテス(Oomycetes)、キトリジオミセテス(Chytridiomycetes)、ジゴミセテス(Zygomycetes)、アスコミセテス(Ascomycetes)、バシジオミセテス(Basidiomycetes)、デューテロミセテス(Deuteromycetes)等の制御に用いることができる。

【0015】

本発明による活性化合物の組み合わせは、穀類疾患(例えば、エリシフェ(Erysiphe)、コクリロボラス(Cochliobolus)、ピレノフォラ(Pyreno

50

phora)、リンコスボリウム(*Rhynchosporium*)、セプトリア(*Septoria*)、フサリウム(*Fusarium*)、シュードセルコスボレリア(*Pseudocercosporaella*)およびレプトスファエリア(*Leptosphaeria*)、パクシニア(*Puccinia*)、ウスチラゴ(*Ustilago*)、チレティス(*Tilletia*)およびウロシスチス(*Urocystis*)の制御、並びに非穀物(例えば、蔓植物、果実、ラッカセイ、野菜)における真菌感染[例えば、フィトフトラ(*Phytophthora*)、プラスモバラ(*Plasmopara*)、フィチウム(*Pythium*)、真菌のうどん粉病(例えば、スフェロテカ(*Sphaerotilus*)もしくはウンシヌラ(*Uncinula*))、並びに斑点病の原因微生物(例えば、ベンツリア(*Venturia*)、アルテルナリア(*Alternaria*)およびセプトリア(*Septoria*)及びさらに、リゾクトニア(*Rhizoctonia*)、ボトリチス(*Botrytis*)、スクレロチニア(*Sclerotinia*)およびスクレロチウム(*Sclerotium*))]の制御に特に適する。
10

【0016】

活性化合物の組み合わせが植物疾患の制御に求められる濃度で植物によって十分に寛容されるという事実は、植物の地上部、増殖貯蔵物および種子、並びに土壌の処理を可能にする。本発明による活性化合物の組み合わせは葉への適用に、さもなければ種子ドレッシングとして用いることもできる。

【0017】

本発明による活性化合物の組み合わせは収穫量の増加にも適する。さらに、毒性が減少されており、植物によって十分に寛容される。

20

【0018】

本発明によると、すべての植物および植物の部分を処理することが可能である。植物は、ここでは、すべての植物および植物群、例えば、望ましい、および望ましくない野生植物または作物(天然作物を含む)を意味するものと理解されるべきである。作物は、トランジジェニック植物および植物育種者証書によって保護可能であるかもしくは保護不可能である植物品種を含む、通常の育種および最適化法もしくは生物工学的および遺伝子工学的方法またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であり得る。植物の部分は、すべての地上および地下部分並びに植物器官、例えば、苗条、葉、花および根を意味するものと理解されるべきであり、言及することができる例は、葉、針葉、茎、幹、花、果実体、果実および種子であり、並びにまた、根、塊茎、根茎である。植物の部分には収穫された植物および野菜並びに生殖増殖材料、例えば、苗、塊茎、根茎、切断体および種子も含まれる。

30

【0019】

活性化合物を用いる本発明による植物および植物部分の処理は、直接または通常の処理方法によるこれらの環境、生息地もしくは保存領域に対する活性によって、例えば、浸漬、スプレー、蒸散、アトマイズ、散布、刷毛塗りによって、および増殖材料の場合、特に種子の場合、さらに単層もしくは多層被覆によって、行う。

【0020】

本発明による活性化合物の組み合わせは、通常の調合物に、例えば、溶液、エマルジョン、懸濁液、粉末、フォーム、ペースト、顆粒、エアロゾル、および種子用の、ポリマー物質中の被覆および組成物中の微量封入物、並びにULV調合物に、変換することができる。

40

【0021】

これらの調合物は、公知の方法によって、例えば、活性化合物または活性化合物の組み合わせを、液体溶媒、加圧下の液化ガスおよび/または固体単体である增量剤と、場合により、乳化剤および/または分散剤である表面活性剤および/または発泡剤を用いて、混合することによって調製する。用いられる增量剤が水である場合、例えば、有機溶媒を補助溶媒として用いることも可能である。本質的に、適切な液体溶媒には、芳香族物質(例えば、キシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン)塩素化芳香族物質もしくは塩素

50

化脂肪族炭化水素（例えば、クロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン）脂肪族炭化水素（例えば、シクロヘキサンもしくはパラフィン、例えば、石油画分）アルコール（例えば、ブタノールもしくはグリコール）、並びにこれらのエーテルおよびエステル、ケトン（例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサン）強極性溶媒（例えば、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド）、さもなければ水が含まれる。液化ガス状増量剤または坦体は、周囲温度および大気圧下で気体である液体、例えば、エアロゾル噴射剤、例えば、ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素を意味するものと理解されるべきである。適切な固体坦体は、例えば、粉碎天然無機物（例えば、カオリン、粘土、タルク、白亜、水晶、アタバルドガイト、モンモリロナイトもしくは珪藻土）および粉碎合成無機物（例えば、微細シリカ、アルミナおよびケイ酸塩）である。顆粒に適する固体坦体は、例えば、粉碎および微細化天然岩石（例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石および苦灰石、さもなければ無機および有機金属の合成顆粒、並びに有機物質の顆粒（例えば、木屑、ココナツの殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ葉柄）である。適切な乳化剤および／または発泡剤は、例えば、非イオン性およびアニオン性乳化剤（例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル（例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネート））、さもなければタンパク質加水分解物である。適切な分散剤は、例えば、リグニン・亜硫酸廃液およびセルロースである。

【0022】

10

粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース並びに（粉末、顆粒またはラテックスの形体にある）天然および合成ポリマー（例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテート）、さもなければ天然リン脂質（例えば、セファリンおよびレシチン）および合成リン脂質を調合物に用いることができる。他の添加物は鉱物および植物油であり得る。

【0023】

着色料（例えば、無機色素（例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびブルシアンブルー、および有機染料（例えば、アリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料））、並びに微量栄養素（例えば、鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩）を用いることができる。

30

【0024】

調合物は、一般に、0.1から95重量%の活性化合物、好ましくは、0.5から90%を含む。

【0025】

本発明による活性化合物の組み合わせは、そのまま、またはこの調合物において、例えば、活性スペクトルを広げ、または耐性の発生を防止するため、公知殺真菌剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、殺線虫剤または殺昆虫剤との混合物として適用することもできる。

【0026】

他の公知活性化合物、例えば、除草剤または肥料および成長調節剤との混合物も可能である。

40

【0027】

活性化合物の組み合わせは、そのまま、調合物の形体で、またはこれらから調製された使用形態として（例えば、即時使用溶液、乳化性濃縮物、エマルジョン、懸濁液、湿潤性粉末、可溶性粉末および顆粒として）用いることができる。これらは、通常の方法によって、例えば、灌水、スプレー、アトマイズ、撒布、散布によって、および乾燥種子処理用の粉末、種子処理用の溶液、種子処理用の水溶性粉末、スラリー処理用の水溶性粉末として、または被覆によって、用いられる。

【0028】

本発明による活性化合物の組み合わせを用いるとき、適用率は、適用の種類に依存して、比較的広い範囲で変化し得る。植物の部分の処理においては、活性化合物の組み合わせ

50

の適用率は、一般に0.1から10000g/h a、好ましくは10から1000g/h aである。種子の処理においては、活性化合物の組み合わせの適用率は、一般に種子のキログラム当たり0.001から50g、好ましくは種子のキログラム当たり0.01から10gである。土壤の処理においては、活性化合物の組み合わせの適用率は、一般に0.1から10000g/h a、好ましくは1から5000g/h aである。

【0029】

本発明による活性化合物の組み合わせの良好な殺真菌活性は以下の例から明らかである。個々の活性化合物は殺真菌活性に関して弱点を示すが、3種類の活性化合物で構成された組み合わせは個々の活性の合計を上回る活性を有する。

【0030】

殺真菌性における相乗効果は、活性化合物の組み合わせの殺真菌活性が個別に適用された活性化合物の活性の合計を上回るとき、常に存在する。

【0031】

2または3種類の活性化合物の所定の組み合わせに期待される活性は、以下のように、S.R. Colby (‘Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations’, Weeds 1967, 15, 20-22)に従って計算することができる：

Xは活性化合物Aをm g/h aの適用率で用いるときの効力を示し、

Yは活性化合物Bをn g/h aの適用率で用いるときに効力を示し、

Zは活性化合物Cをr g/h aの適用率で用いるときの効力を示し、

E_1 は活性化合物AおよびBをmおよびn g/h aの適用率で用いるときの効力を示し、並びに

E_2 は活性化合物AおよびBおよびCをmおよびnおよびr g/h aの適用率で用いるときの効力を示すとして、

【0032】

【数1】

$$E_1 = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

であり、および3種類の活性化合物の組み合わせについては：

【0033】

【数2】

$$E_2 = X + Y + Z - \frac{X \cdot Y - X \cdot Z - Y \cdot Z}{100} + \frac{X \cdot Y \cdot Z}{10000}$$

である。

【0034】

効力はここでは%で決定される。0%は対照のものに相当する効力を示し、これに対して100%の効力は感染が観察されないことを意味する。

【0035】

実際の殺真菌活性が算出されたものを上回る場合、この組み合わせの活性は付加的である。換言すると、相乗効果が得られる。この場合、実際に観察される効力は、それぞれ、期待される効力 E_1 および E_2 についての上記式を用いて算出される値を上回らなければならない。

【0036】

本発明を下記例によって説明する。しかしながら、本発明はこの例に限定されるもので

10

20

30

40

50

はない。

【実施例】

【0037】

エリシフェ (Erysiphe) 試験 (コムギ) / 治療的

溶媒: 50重量部のN, N-ジメチルアセトアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製品を製造するため、1重量部の活性化合物または活性化合物の組み合わせを明記された量の溶媒および乳化剤と混合し、この濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【0038】

10

治療的活性について試験するため、若い植物にエリシフェ・グラミニス・エフSP・トリチシ (Erysiphe graminis f. sp. Tritici) の胞子をまぶし、接種の48時間後、これらの植物に活性化合物の調製品を明記される適用率でスプレーする。

【0039】

これらの植物を約20の温度および約80%の相対大気湿度の温室内に入れてうどん粉病膿疱の発生を促進する。

【0040】

接種の8日後に評価を行う。0%は対照のものに相当する効力を意味し、これに対して100%の効力は感染が観察されないことを意味する。

20

【0041】

【表1】

表

エリシフェ(Erysiphe)試験/治療的

活性化合物	g/ha表示の活性化合物適用率	%表示の効力	
		実測値*	算出値**
(I) フルキオサストロビン	50	11	
(II) プロチオコナゾール	50	0	
(III) テブシナゾール	50	22	
(I) + (II) 1:1	50 + 50	44	11
(I) + (III) 1:1	50 + 50	67	31
(II) + (III) 1:1	50 + 50	89	22
(I) + (II) + (III) 1:1:1	50 + 50 + 50	100	31

30

* 実測値=見出された活性

** 算出値=Colby式を用いて算出された活性

40

フロントページの続き

(72)発明者 ダーメン , ペーター
　　ドイツ国、4 1 4 7 0 ・ノイス、アルテブリュツカー・シユトラーセ・6 1
(72)発明者 マオラー - マハニク , アストリット
　　ドイツ国、4 2 7 9 9 ・ライヒリンゲン、ノイエンカムパー・ベーク・4 8
(72)発明者 シュティ - ハインツ , アンヌ
　　ドイツ国、4 0 7 6 4 ・ランゲンフエルト、シユリーパー・シユトラーセ・2 9
(72)発明者 ケルツ - モーレンデイツク , フリードリヒ
　　ドイツ国、5 1 3 7 7 ・レバークーゼン・シユレブツシユラス・2 9

審査官 大熊 幸治

(56)参考文献 特表2 0 0 1 - 5 2 0 6 6 5 (J P , A)
特表2 0 0 2 - 5 3 0 2 9 7 (J P , A)
特表2 0 0 1 - 5 0 5 8 8 6 (J P , A)
特表2 0 0 1 - 5 2 0 6 5 5 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , DB名)

A01N 43/88
A01N 25/30
A01N 43/653
A01P 3/00
CA/REGISTRY(STN)